

## WO0009481

### Publication Title:

CYCLIC AMIDE COMPOUNDS, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, INTERMEDIATES THEREOF AND HERBICIDES

### Abstract:

#### Abstract of WO0009481

Cyclic amide compounds having two substituents at the alpha -position of the carbonyl group or salts thereof. These compounds exert an excellent herbicidal effect on weeds over a broad range (for example, lowland weeds and upland weeds) at a low dosage and yet cause little chemical injury on cultivated plants such as rice, wheat, barley, soybean, corn and cotton, thereby achieving an excellent selective herbicidal effect. This selective herbicidal effect is sustained over a long time. Moreover, these compounds are little toxic to mammals, fish and shellfish and induce no environmental pollution. Thus, they can be highly safely used as herbicides for lowlands, uplands, orchards or non-crop lands. Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

-----  
Courtesy of <http://v3.espacenet.com>



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類6 C07D 207/36, 207/38, 211/90, 401/06, 405/06, 471/04, A01N 43/36, 43/40</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO00/09481</p> <p>(43) 国際公開日 2000年2月24日(24.02.00)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP99/04327</p> <p>(22) 国際出願日 1999年8月10日(10.08.99)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平10/227431 1998年8月11日(11.08.98) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 武田薬品工業株式会社 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)(JP/JP) 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてののみ) 符阪隆文(FUSAKA, Takafumi)(JP/JP) 〒305-0047 茨城県つくば市千現1丁目23番地4 マイコーポニノ宮201号 Ibaraki, (JP) 田中 易(TANAKA, Yasushi)(JP/JP) 〒305-0821 茨城県つくば市春日1丁目7番地9 武田春日ハイツ204号 Ibaraki, (JP) 門脇 敦(KADOWAKI, Atsushi)(JP/JP) 〒305-0035 茨城県つくば市松代3丁目12番地1 武田松代レジデンス513号 Ibaraki, (JP)</p>		<p>(74) 代理人 弁理士 朝日奈忠夫, 外(ASAHI, Tadao et al.) 〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町2丁目17番85号 武田薬品工業株式会社 大阪工場内 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AE, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(54)Title: CYCLIC AMIDE COMPOUNDS, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, INTERMEDIATES THEREOF AND HERBICIDES</p> <p>(54)発明の名称 環状アミド化合物、その製造法、中間体及び除草剤</p> <p>(57) Abstract Cyclic amide compounds having two substituents at the <math>\alpha</math>-position of the carbonyl group or salts thereof. These compounds exert an excellent herbicidal effect on weeds over a broad range (for example, lowland weeds and upland weeds) at a low dosage and yet cause little chemical injury on cultivated plants such as rice, wheat, barley, soybean, corn and cotton, thereby achieving an excellent selective herbicidal effect. This selective herbicidal effect is sustained over a long time. Moreover, these compounds are little toxic to mammals, fish and shellfish and induce no environmental pollution. Thus, they can be highly safely used as herbicides for lowlands, uplands, orchards or non-crop lands.</p>		

## (57)要約

本発明は、カルボニル基の $\alpha$ 位の置換基として2個の置換基を有する環状アミド化合物またはその塩に関する。

低薬量で広範囲の雑草、例えば水田雑草、畑地雑草等に対して優れた殺草作用を有する。しかも栽培植物、例えばイネ、コムギ、オオムギ、ダイズ、トウモロコシ、ワタ等に対して薬害が少なく、優れた選択的除草効果を示す。また選択的除草効果は長期間持続する。哺乳動物や魚貝類に対して低毒性で、環境を汚染することもなく、水田、畑、果樹園あるいは非農耕地用等の除草剤としてきわめて安全に使用することができる。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE アラブ首長国連邦	DM ドミニカ	KZ カザフスタン	RU ロシア
AL アルバニア	EE エストニア	LC セントルシア	SD スーダン
AM アルメニア	ES スペイン	LJ リヒテンシュタイン	SE スウェーデン
AT オーストリア	FI フィンランド	LK スリ・ランカ	SG シンガポール
AU オーストラリア	FR フランス	LR リベリア	SI スロヴェニア
AZ アゼルバイジャン	GA ガボン	LS レソト	SK スロヴァキア
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB 英国	LT リトアニア	SL シェラ・レオネ
BB バルバドス	GD グレナダ	LU ルクセンブルグ	SN セネガル
BF ベルギー	GE グルジア	LV ラトヴィア	SZ スワジランド
BF ベルギー・ファン	GH ガーナ	MA モロッコ	TG トーゴ
BG ブルガリア	GM ガンビア	MC モナコ	TD チャード
BJ ベナン	GN ギニア	MD モルドヴァ	TG トーゴ
BR ブラジル	GW ギニア・ビサウ	MG マダガスカル	TJ タジキスタン
BY ベラルーシ	GR ギリシャ	MC マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TZ タンザニア
CA カナダ	HR クロアチア	共和国	TM トルクメニスタン
CF 中央アフリカ	HU ハンガリー	マリ	TR トルコ
CG コンゴ	ID インドネシア	ML モンゴル	TT トリニダード・トバゴ
CH スイス	IE アイルランド	MN モンゴル	UA ウクライナ
CI コートジボアール	IL イスラエル	MR モーリタニア	UG ウガンダ
CM カメルーン	IN インド	MW マラウイ	US 米国
CN 中国	IS アイスランド	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CR コスタ・リカ	IT イタリア	NE ニジェール	VN ヴェトナム
CU キューバ	JP 日本	NL オランダ	YU ユーゴスラビア
CY キプロス	KE ケニア	NO ノールウェー	ZA 南アフリカ共和国
CZ チェコ	KG キルギスタン	NZ ニュー・ジースランド	ZW ジンバブエ
DE ドイツ	KP 北朝鮮	PL ポーランド	
DK デンマーク	KR 韓国	PT ポルトガル	
		RO ルーマニア	

## 明 細 書

環状アミド化合物、その製造法、中間体及び除草剤

## 5 技術分野

本発明は優れた選択的除草活性を示す新規な環状アミド化合物またはその塩、その製造法、その合成中間体、該環状アミド化合物を含有する除草剤及び該環状アミド化合物を含有する水面浮遊性粒剤または水性懸濁剤に関する。

## 10 背景技術

本発明の一般式（I）で表される環状アミド化合物はカルボニル基の $\alpha$ 位に2つの置換基 $R^4$ 及びZを有する（即ち、カルボニル基の $\alpha$ 位が4級炭素である）新規な化合物であり、種々の水田雑草、畑地雑草に対して優れた殺草作用を有し、しかもイネ、コムギ、オオムギ、ダイズ、トウモロコシ、ワタ等の栽培作物に対して実質的な薬害はなく、水田や畑地等において優れた選択的除草剤として用いられる。

現在、除草作用を有する種々の環状アミド化合物が報告されている（例えば特開平3-204855、5-221972、5-221973、6-25160、6-172306、7-179420、7-291926、7-300456、  
20 7-330722、8-119937、8-151364、8-311026、8-325230、9-124596号公報等）。しかしこれらの環状アミド化合物の中でカルボニル基の $\alpha$ 位の置換基として2個の置換基を有する（即ち、カルボニル基の $\alpha$ 位が4級炭素である）化合物は記載されていない。従ってこれらの化合物は本発明中の環状アミド化合物とは構造が全く異なっている。

25 これらの従来技術の環状アミド化合物は、雑草に対する殺草効果、栽培作物に対する薬害、哺乳動物や魚介類に対する毒性、環境汚染の面などでまだ十分な性能を有しているとは言えず、これらの点につき、さらに改良された選択的除草剤の開発が切望されている。

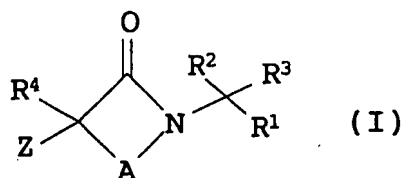


## 発明の開示

本発明者らは、優れた殺草活性を有し、しかも作物に薬害のない、選択性除草剤の開発をめざし、鋭意研究を重ねた結果、一般式（I）で表される化合物またはその塩が強力な殺草活性を有し、しかもイネ、コムギ、オオムギ、ダイズ、トウモロコシ、ワタ等の栽培作物に対し、薬害が顕著に軽減され、高い選択性除草作用を示すことを知見し、さらにこれらの知見に基づいて種々検討を重ねた結果、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は、

〔1〕一般式



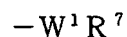
〔式中、 $R^1$ は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



（式中、 $R^5$ 及び $R^6$ はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。）で表される基を示し、

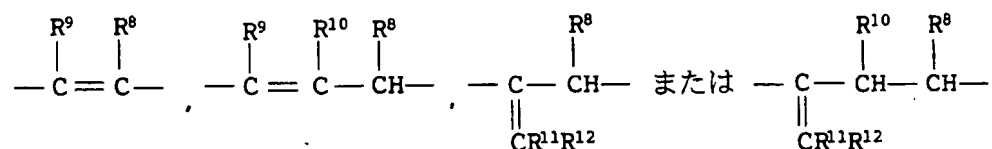
$R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示すか、または $R^2$ 及び $R^3$ は隣接する炭素原子と一緒に置換されていてもよい3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、

$R^4$ は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式

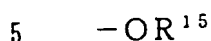


（式中、 $W^1$ は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $R^7$ は置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。）で表される基を示し、

—A—は式



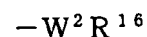
(式中、 $\text{R}^8$ は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、 $\text{R}^9$ は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基または式



(式中、 $\text{R}^{15}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。) で表される基を示し、

$\text{R}^{10}$ は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、

$\text{R}^{11}$ は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $\text{W}^2$ は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $\text{R}^{16}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示す。) で表される基を示し、

15  $\text{R}^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、ここで、 $\text{R}^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $\text{R}^9$ または $-\text{C}-\text{R}^{11}\text{R}^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。) で表される基を示し、

Zはハロゲン原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよいアシル基または式



(式中、 $\text{R}^{5a}$ 及び $\text{R}^{6a}$ はそれぞれ水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示す。) で表される基を示す。]で表される化合物(以下、化合物(I)と略称する場合がある。) またはその塩、

25 [2]  $\text{R}^1$ は[1] $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-}$

$C_{1-9}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、

(1)ヒドロキシ基、

5 (2)アミノ基、

(3)シアノ基、

(4)スルファモイル基、

(5)スルファモイルオキシ基、

(6)メルカプト基、

10 (7)ニトロ基、

(8)ハロゲン原子、

(9)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されて

15 いてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル

25

- ルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子
- 5 (オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮
- 10 合環基、
- (10)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル
- 15 基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基(該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル
- 20 基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～
- 25 3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置

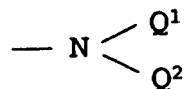
- 換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケ  
ニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個  
置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カル  
ボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、  
5  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$   
アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ ア  
ルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、  
 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、  
10 シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキ  
ルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。) )
- (ii) 式-T-Q<sup>0</sup> [式中、Q<sup>0</sup>は(a)それぞれハロゲンで1～5個置換されてい  
てもよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アル  
ケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$   
15 アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケ  
ニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハ  
ロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアル  
キル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、  
 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されてい  
20 てもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオ  
キシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、  
 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アル  
キニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリー  
ル-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキ  
25 シ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロア  
ルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロ  
ゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$   
アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリー

ルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル  
スルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル  
基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$   
アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプ  
5 ト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、  
 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよ  
い $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基お  
よび $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換  
10 されていてよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオ  
キシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子  
および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘ  
テロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベン  
ゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および  
15 硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原  
子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、または(c)ホルミル基、  
 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アル  
キニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリ  
ール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキ  
20 シ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロア  
ルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～  
6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセ  
チル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケ  
ニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケ  
25 ニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロ  
キシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチ  
オ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カ  
ルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ  
イミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されて

いてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子およびC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)を、TはO、-S(O)<sub>k</sub>- (kは0, 1または2を示す) またはS-Sを示す]で表される基、

(12)式



20

[式中、Q<sup>1</sup>は(a)水素原子、(b)それぞれハロゲンで1～5個置換されていてもよい(i)C<sub>1-6</sub>アルキル基、(ii)C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、(iii)C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(iv)C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、(v)C<sub>2-6</sub>アルキニル基、(vi)C<sub>6-14</sub>アリール基、(vii)C<sub>7-19</sub>アラルキル基、(viii)C<sub>8-20</sub>アリールアルケニル基および(ix)C<sub>8-20</sub>アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基または(c)ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>ア

25

ルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)を、 $Q^2$ は(a)それぞれハロゲンで1～5個置換されていてもよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニ

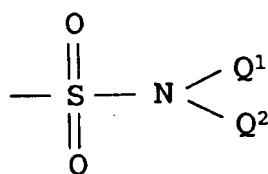


ル基, (iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基, (v)  $C_{2-6}$ アルキニル基, (vi)  $C_{6-14}$ アリール基, (vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基, (viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基または(b)ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基, 5 ~ 6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5 ~ 6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基(該アシル基がアルキルカルボニル基, アルケニルカルボニル基, アルキニルカルボニル基, アルコキシカルボニル基, アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ, シアノ, スルファモイル, メルカプト, カルボキシ,  $C_{1-6}$ アルキルチオ基, ハロゲン原子,  $C_{1-6}$ アルコキシ基, ニトロ基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基, アミノ, モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基,  $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1 ~ 3個置換されている)もよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5 ~ 6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5 ~ 6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1 ~ 3個置換されている)もよい $C_{1-6}$ アルキル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル基,  $C_{2-6}$ アルケニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル基, ハロゲンで1 ~ 3個置換されている)もよい $C_{1-6}$ アルコキシ基, ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル

オキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ  
 ルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、  
 アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロ  
 5 ゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換され  
 ていてもよい。)を、または $Q^1$ および $Q^2$ は隣接する窒素原子とともに3ない  
 し7員環を形成してもよい。)で表される基、

(13)式



〔式中の記号は前記と同意義を示す〕で表される基、

- 10 (14) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アル  
 ケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$   
 アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニ  
 ル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハ  
 15 ロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアル  
 キル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、  
 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されてい  
 てもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオ  
 キシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、  
 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アル  
 20 キニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリー  
 ルカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキ  
 シカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロア  
 ルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$   
 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロ  
 25 ゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$   
 アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリー

ルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル  
スルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル  
基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$   
アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプ  
5 ト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、  
 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよ  
い $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基お  
よび $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換  
10 されていてよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオ  
キシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子  
および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘ  
テロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベ  
ンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および  
15 硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原  
子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$   
アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール  
-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ  
-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアル  
20 キルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～  
6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセ  
チル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケ  
ニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケ  
25 ニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロ  
キシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチ  
オ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カ  
ルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ  
イミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されて

いてもよく、

- 該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1  
5 ～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ  
10 ルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)で1ないし2個置換されていてもよいカルバモイル基、
- (15) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b) ハ  
20 ロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキ
- 25

シーカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケ

ニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)で1ないし2個置換されていてもよいカルバモイルオキシ基、(16) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b) ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されてい

てもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアル

キルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されている）もよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されている）もよい。）で1ないし2個置換されている）もよいウレイド基、

(17) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$



- $_4$ アリール基, (vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基, (viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基, (b)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、
- 5  $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原
- 10
- 15
- 20
- 25

子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基, 5～6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基(該アシル基がアルキルカルボニル基, アルケニルカルボニル基, アルキニルカルボニル基, アルコキシカルボニル基, アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ, シアノ, スルファモイル, メルカプト, カルボキシ,  $C_{1-6}$ アルキルチオ基, ハロゲン原子,  $C_{1-6}$ アルコキシ基, ニトロ基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基, アミノ, モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基,  $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5～6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル基,  $C_{2-6}$ アルケニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル基, ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基, ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基, ニトロ基,

- アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてよい。)で1ないし2個置換されていてよいチオカルバモイル基、
- (18)カルボキシ基、
- 5 (19)式 $-O-SO_2-Q^2$ 〔式中、 $Q^2$ は前記と同意義を示す〕で表される基、
- (20)スルホ基、
- (21)式 $=N-OR^{14}$ 〔式中、 $R^{14}$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基またはハロゲンで1～3個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を示す〕で表される基および
- 10 (22) $C_{3-6}$ シクロアルキル基からなる群(以下、置換基群(A))から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてよい。
- 上記炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換
- 15 されていてよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、
- 20 [2]ハロゲンで1～3個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ ア
- 25

ラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲン  
 で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケ  
 ニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフ  
 イニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル  
 5 基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ ア  
 リールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミ  
 ノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原  
 子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルス  
 ルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチ  
 10 オ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリー  
 ルチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、また  
 は隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒  
 素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたは  
 ジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3  
 15 ～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキ  
 シド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化  
 されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環  
 との縮合環基または

[3]式

20  $-\text{CONR}^5\text{R}^6$

（式中、 $\text{R}^5$ 及び $\text{R}^6$ はそれぞれ(1)水素原子、(2) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シク  
 ロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
 ニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル  
 基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基  
 25 がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記  
 置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化  
 水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、  
 アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記  
 置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい

$C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。) または(3)ハロゲン

5 で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子(オキシド化されて

10

15

20

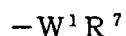
25

いてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基を示す。)で表される基を示し、

- 5  $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基(該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群(A)から選ばれる1~4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロ
- 10 アルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1~5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる
- 15 置換基で1~5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)を示すか、または $R^2$ 及び $R^3$ は隣接する炭素原子と一緒にあって、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、
- 20 ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル
- 25

- 基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい、3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、
- $R^4$ は(1) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アララルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アララルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アララルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アララルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アララルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、

ルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボ  
 ニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$   
 アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、  
 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボ  
 5 ニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボ  
 ニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、  
 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ ア  
 リールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキ  
 ルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル  
 10 基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$   
 アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、  
 ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$   
 アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$   
 アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-}$   
 15  $_{14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されてい  
 もよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成  
 してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子  
 （モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ない  
 し4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒  
 20 素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたは  
 ジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3  
 ～8員複素環との縮合環基または(3)式

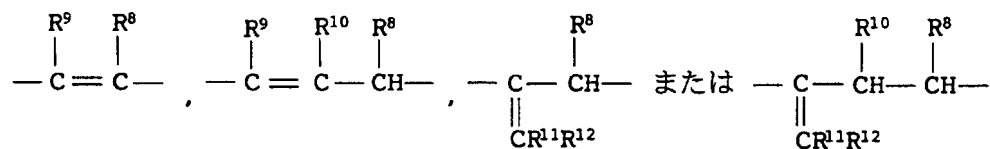


（式中、 $W^1$ は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫黄  
 25 原子を、 $R^7$ は(1) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニ  
 ル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$   
 アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキ  
 ニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基また  
 はアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～



4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1~5個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基およびC<sub>7-19</sub>アラルキル基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。) または(2)ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基、C<sub>7-19</sub>アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルフィニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルホニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルチオ基およびC<sub>6-14</sub>アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチ

レンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基を示す。）で表される基を示し、  
 5 —A—は式



（式中、 $\text{R}^8$ は水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基、 $\text{C}_{8-20}$ アリールアルケニル基および $\text{C}_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群  
 10 （A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基および $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2  
 20 つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）を示し、 $\text{R}^9$ は(1)水素原子、(2)シアノ基、(3) $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基、 $\text{C}_{8-20}$ アリールアルケニル基および $\text{C}_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置  
 25

- 換基群 (A) から選ばれる 1~4 個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群 (A) から選ばれる置換基、ハロゲンで 1~5 個置換されていてもよい。
- 5 よい  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{3-6}$  シクロアルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{3-6}$  シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{6-14}$  アリール基および  $C_{7-19}$  アラルキル基から選ばれる置換基で 1~5 個置換されていてもよく、隣接する 2 つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、(4) ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{3-6}$  シクロアルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{3-6}$  シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{6-14}$  アリール基、 $C_{7-19}$  アラルキル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$  アリールオキシ基、 $C_{7-19}$  アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$  アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$  アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$  シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$  アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$  シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$  アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$  アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$  アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$  アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$  アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$  アリールスルフィニル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$  アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$  アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$  アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$  アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{2-6}$  アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$  アルキニルチオ基および  $C_{6-14}$  アリールチオ基からなる群から選ばれる 1~3 個の置換
- 10
- 15
- 20
- 25

基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、(5)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカル

- ポニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよい。) 、または(6)
- 式
- 10  $-OR^{15}$
- (式中、 $R^{15}$ は(i)水素原子、(ii) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基(該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群(A)から選ばれる1~4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1~5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。) 、または(iii)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-}$

6シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アル  
コキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$   
アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
5 アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル  
スルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置  
換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル  
基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、  
10 アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、  
スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アル  
キル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1  
~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、  
 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1  
15 ~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒にな  
ってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていても  
よい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）  
から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員  
複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素  
20 原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれる  
ヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基を示す。）で表され  
る基を示し、

$R^{10}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アル  
ケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、  
25  $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアル  
キニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基ま  
たはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1  
~4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シ  
クロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはア

- リールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置  
 換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シク  
 ロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキ  
 ニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基およびC<sub>7-19</sub>アラルキル基から選ばれる置換基で1  
 5 ～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジ  
 オキシ基を形成してもよい。）を示し、  
 R<sup>11</sup>は(1)水素原子、(2)ハロゲン原子、(3)C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアル  
 キル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、  
 C<sub>6-14</sub>アリール基、C<sub>7-19</sub>アラルキル基、C<sub>8-20</sub>アリールアルケニル基および  
 10 C<sub>8-20</sub>アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキ  
 ル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群  
 （A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基が  
 シクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリール  
 アルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群  
 15 （A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>ア  
 ルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケ  
 ニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基およびC<sub>7-19</sub>アラルキル基か  
 ら選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一  
 緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）(4)ハロゲンで1～3個  
 20 置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アル  
 ケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基、  
 C<sub>7-19</sub>アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキ  
 シ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>6-14</sub>アリール  
 オキシ基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニ  
 25 ル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>  
 シクロアルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>ア  
 ルコキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub>アル  
 キニルオキシ-カルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>  
 アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-</sub>

19 アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルフィニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルホニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルチオ基およびC<sub>6-14</sub>アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、または(5)式

$$-W^2R^{16}$$

（式中、W<sup>2</sup>は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫黄原子を、R<sup>16</sup>は(i)水素原子、(ii)C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基、C<sub>7-19</sub>アラルキル基、C<sub>8-20</sub>アリールアルケニル基およびC<sub>8-20</sub>アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>3-6</sub>



シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、

(iii)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子

子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれる  
ヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、または(iv)ホル  
ミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、  
 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_6$   
5  $-_{14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケ  
ニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$   
シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル  
基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニ  
ル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員  
10 複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、  
アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、  
アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、  
ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アル  
キルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキ  
15 シ-カルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アル  
コキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換  
されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロア  
ルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボ  
20 ニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素  
環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置  
換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケ  
ニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個  
置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カル  
25 ボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、  
 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$   
アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ ア  
ルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、  
 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、C

$_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)を示す。)で表される基を示し、

- 5  $R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)を示し、
- 10
- 15

ここで、 $R^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $R^9$ または $=CR^{11}R^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。)で表される基を示し、

20

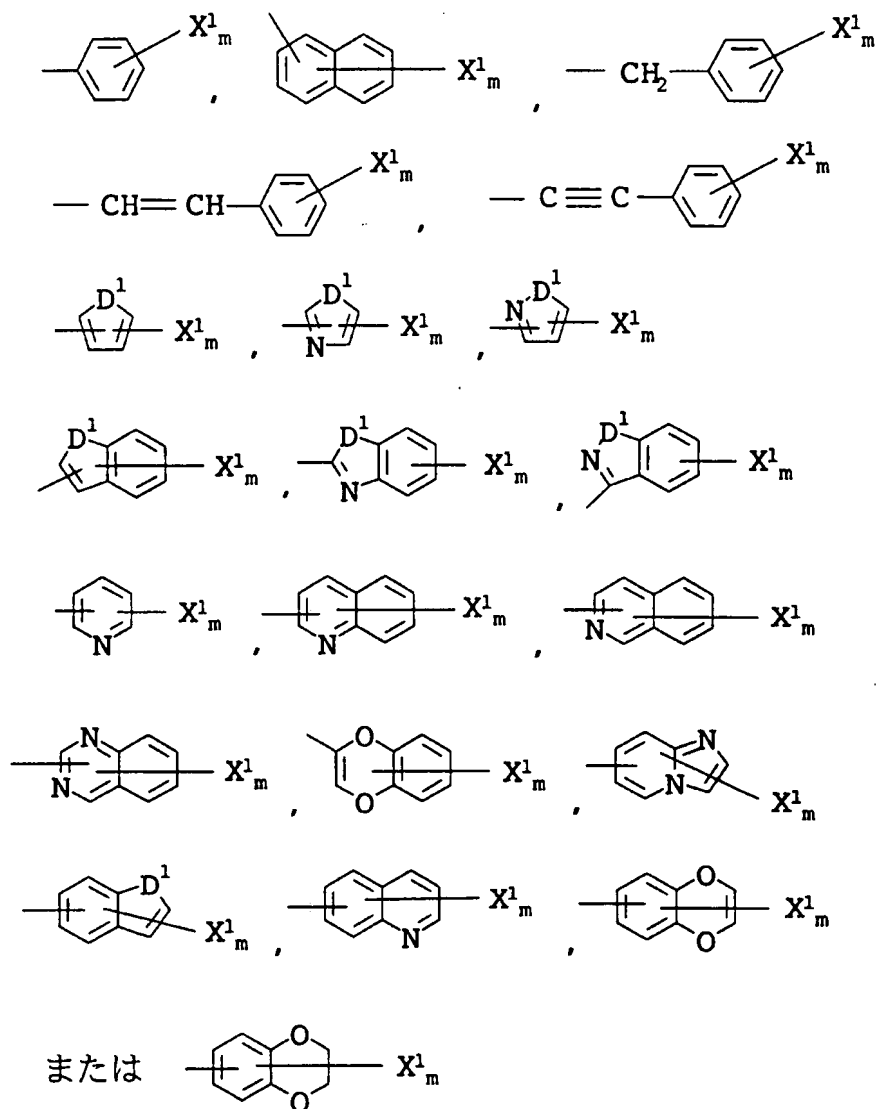
- Zは(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されて
- 25

いてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）、

- 5 (4)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

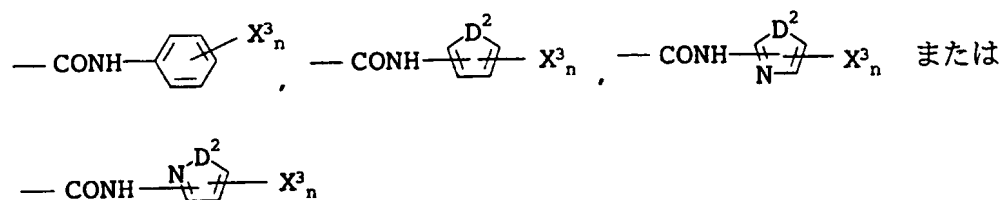
- 20 該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ ア

- ルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。) または(5)式
- 5  $-CONR^{5a}R^{6a}$
- (式中、 $R^{5a}$ 及び $R^{6a}$ はそれぞれ水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基(該炭化水素基
- 10 がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群(A)から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記
- 15 置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)を示す。)で表される基を示す上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、
- 20 〔3〕 $R^1$ が式



5 [式中、 $X^1$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルス

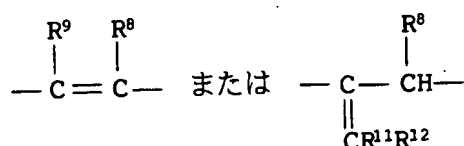
- ルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、アミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、  
 5 またはC<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基を示すか、隣接する2つのX<sup>1</sup>が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよく、mは0～3の整数を示し、D<sup>1</sup>は酸素原子、硫黄原子、または式NR<sup>d1</sup>（式中、R<sup>d1</sup>は水素原子、またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を示す。）で表される基を示す。）で表される基、または式



- 10 [式中、X<sup>3</sup>は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、フェノキシ基、ホルムアミド基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、またはニトロ基を、  
 15 nは0～3の整数を、D<sup>2</sup>は酸素原子、硫黄原子、または式NR<sup>d2</sup>（式中、R<sup>d2</sup>は水素原子、またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を示す。）で表される基を示す。]で表される基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、  
 20 〔4〕R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>がそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、  
 〔5〕R<sup>4</sup>が(i)それぞれハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基およびハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよい(i)フェニル基、(ii)ナフチル基または(iii)チエニル基、(2)ハロゲンで1～3個置換されて  
 25

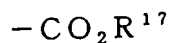
いてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(3)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、(4)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、または(5)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいフェノキシ基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、

5     〔6〕－A－が式



(式中の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、

10     〔7〕Zがハロゲン原子、シアノ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、式



[式中、 $R^{17}$ は(1)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(2)(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(iii)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基で1～3個置換されていてもよい $C_{7-19}$ アラルキル基を示す。]で表される基、式



[式中、 $R^{17X}$ は水素原子またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示す。]で表される基、または式

20     －CONR<sup>5b</sup>R<sup>6b</sup>

[式中、 $R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ はそれぞれ水素原子またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示す。]で表される基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、

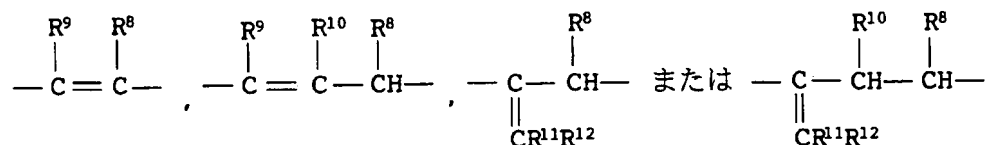
25     〔8〕 $R^8$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、

〔9〕 $R^9$ が(1)水素原子、(2)(i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ基、(iii) $C_{1-6}$ ア



- ルコキシ基、(iv)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(v)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(vi)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(vii)  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基または(viii) 式  $=N-OR^{14}$  [式中、 $R^{14}$ は上記〔2〕項記載と同意義を示す。]で表される基で1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキル基、(3)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(4)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(5)  $C_{1-6}$ アルコキシで1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(6) シアノ基、(7) ホルミル基または(8) ヒドロキシ基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、
- 〔10〕  $R^{10}$ が水素原子または  $C_{1-6}$ アルキル基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、
- 〔11〕  $R^{11}$ が水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基または  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基であり、 $R^{12}$ が水素原子、ハロゲン原子またはハロゲンで1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキル基である上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、
- 〔12〕  $R^{13}$ は(1)ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基もしくは  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基で1~3個置換されていてもよいフェニル基、(2)ナフチル基、(3)ハロゲンで1~3個置換されていてもよいピリジル基、(4)キノリル基、(5)イソキノリル基、(6)  $C_{1-4}$ アルキルで1~3個置換されていてもよいキナゾリニル基、(7)ハロゲンで1~3個置換されていてもよいイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル基、(8)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい1, 4-ベンゾジオキシニル基、(9)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシニル基、(10)ベンゾフラニル基または(11) (i)ハロゲン、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基およびシアノ基から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよいフェニル基または(ii)  $C_{1-6}$ アルキルで1~2個置換されていてもよいチアゾリル基で置換されたカルバモイル基を、 $R^2$ 及び  $R^3$ はそれ

ぞれC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>4</sup>は(1)ハロゲンもしくはC<sub>1-6</sub>アルキル基で1～3個置換されていてもよいフェニル基または(2)C<sub>1-6</sub>アルコキシ基を、-A-は式



- 5 (式中、R<sup>8</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>9</sup>は(1)水素原子、(2)ハロゲン、ヒドロキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルオキシ基、ヒドロキシイミノ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基もしくはC<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルオキシイミノ基で1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、(3)C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、(4)C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(5)C<sub>1-6</sub>アルコキシ基で1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(6)ホルミル基、(7)シアノ基または(8)ヒドロキシ基を、R<sup>10</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>11</sup>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基またはC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基を、R<sup>12</sup>は水素原子を示す。
- 10 )で表される基を、Zは(1)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基、(3)C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基または(4)モノもしくはジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイル基を示す上記〔1〕項記載の化合物またはその塩、
- 20 〔13〕メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレートまたはその塩、
- 〔14〕メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート
- 25 トまたはその塩、
- 〔15〕メチル 1-(1-(N-(2, 5-ジクロロフェニル)カルバモイル

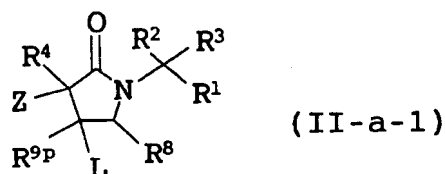
) - 1 - メチルエチル) - 1, 3 - ジヒドロ - 4 - メチル - 2 - オキソ - 3 - フェニル - 2H - ピロール - 3 - カルボキシレートまたはその塩、

[16] メチル 1 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチル) - 1, 3 - ジヒドロ - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2H - ピロール - 3 - カルボキシレートまたはその塩、

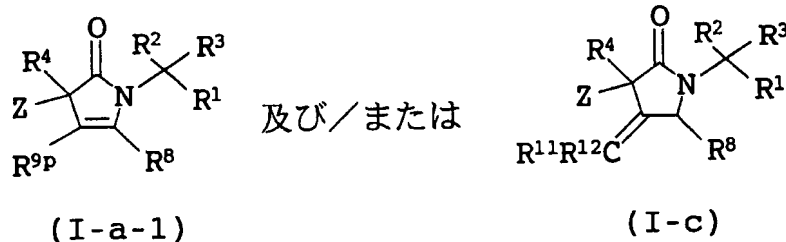
[17] メチル 1 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 4 - メチレン - 2 - オキソピロリジン - 3 - カルボキシレートまたはその塩、

[18] メチル 1 - (1 - (N - (3, 5 - ジクロロフェニル) カルバモイル) - 1 - メチルエチル) - 4 - メチレン - 2 - オキソ - 3 - フェニルピロリジン - 3 - カルボキシレートまたはその塩、

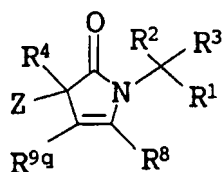
[19] (1) 式



(式中、R<sup>9p</sup>は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を、Lは脱離基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を脱離反応に付し、式



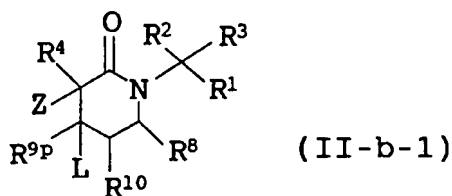
(式中、R<sup>9p</sup>は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-a-1)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させ、式



(I-a-2)

(式中、 $R^{9q}$ は置換されていてもよいアシル基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

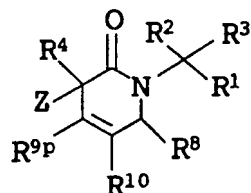
(2) 式



(II-b-1)

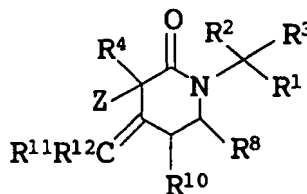
5

(式中、 $R^{9p}$ およびLは前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を脱離反応に付し、式



(I-b-1)

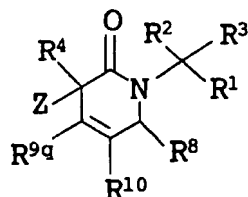
及び/または



(I-d)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-b-1)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させ、式

10

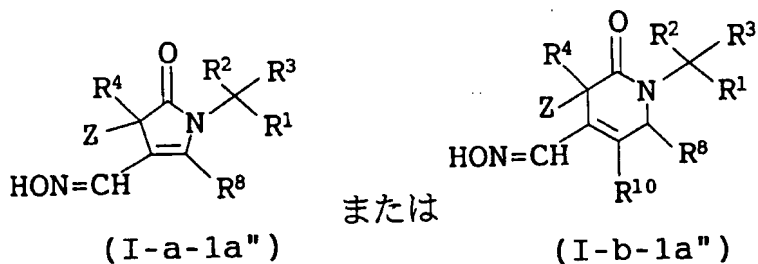


(I-b-2)

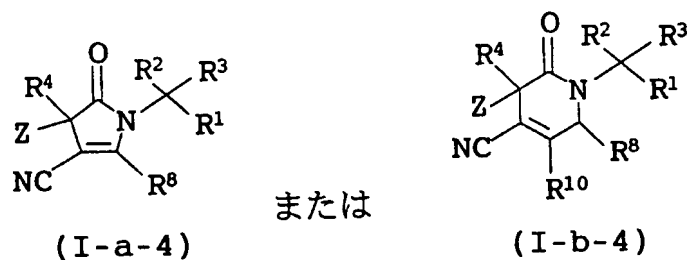
(式中、 $R^{9q}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を

示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(3) 式

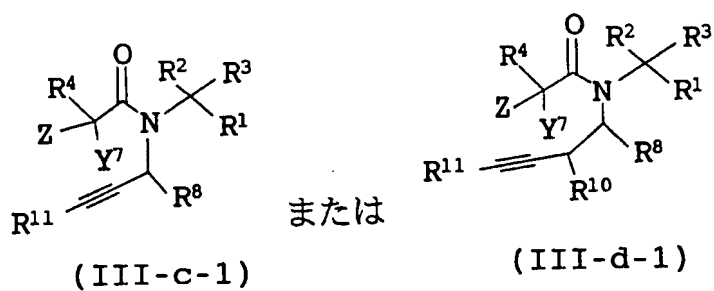


(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物または  
5 その塩を脱水反応に付し、式



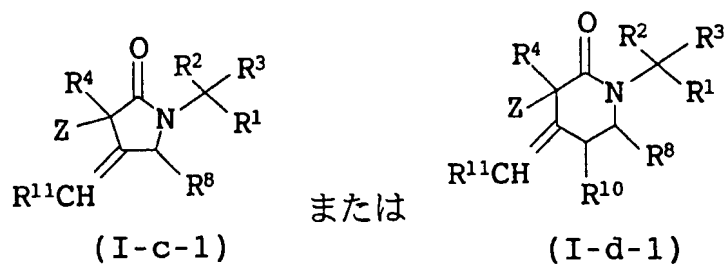
(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物または  
その塩を製造するか、

(4) 式



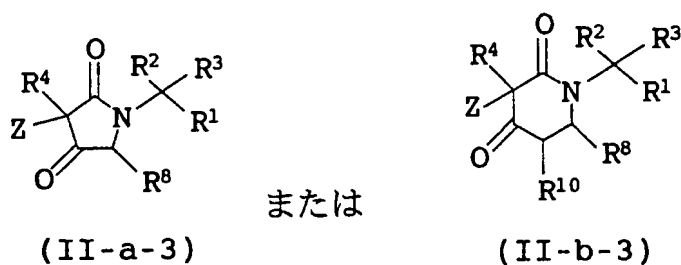
10

(式中、 $Y^7$ はハロゲン原子を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を閉環反応に付し、式



(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(5) 式



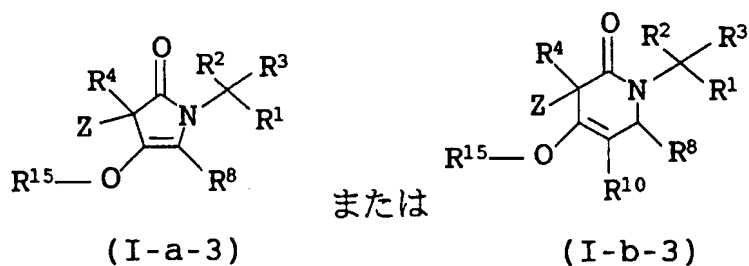
5

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を式

$R^{15} - L^4$

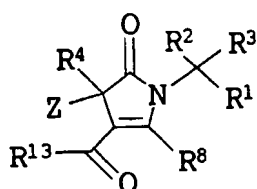
(式中、 $L^4$ は脱離基を、 $R^{15}$ は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩と反応させて、式

10



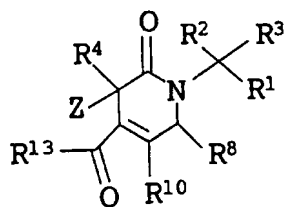
(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(6) 式



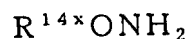
(I-a-2a)

または

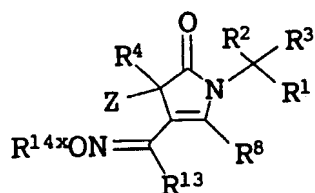


(I-b-2a)

- (式中、 $R^{13}$ は水素原子、またはそれぞれハロゲンで1～3個置換されていて  
もよい (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{6-14}$ アリール基もしくは (iii)  $C_{7-11}$   
 $\alpha$ アラルキル基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表さ  
5 れる化合物またはその塩を式

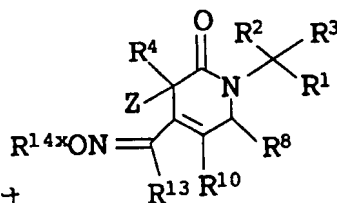


(式中、 $R^{14*}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される化合物  
またはその塩と反応させて、式



(I-a-1a)

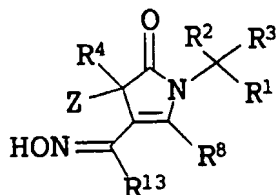
または



(I-b-1a)

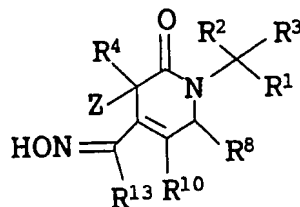
- 10 (式中、 $R^{13}$ 及び $R^{14*}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と  
同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(7) 式



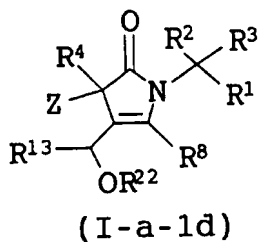
(I-a-1a')

または

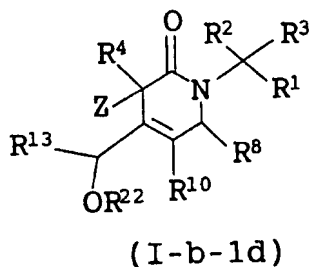


(I-b-1a')

(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を



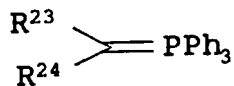
または



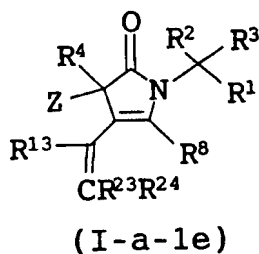
(式中、 $R^{13}$ 及び $R^{22}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(9) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物またはその塩を式

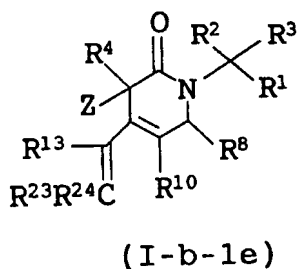
5



(式中、 $R^{23}$ 及び $R^{24}$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル基または $C_{1-6}$ アルコキシ基を、 $Ph$ はフェニル基を示す。) で表される化合物またはその塩と反応させて、式



または



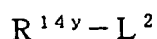
10

(式中、 $R^{13}$ 、 $R^{23}$ 及び $R^{24}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

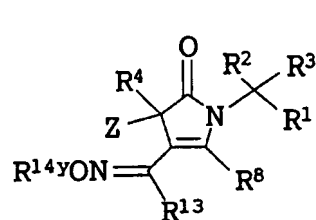
(10) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物またはその塩をフッ素化剤と反応させて、式



示す。)で表される化合物またはその塩を式

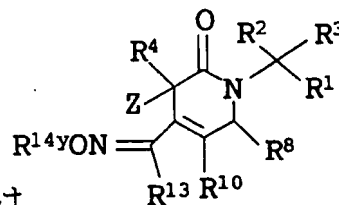


(式中、 $R^{14y}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を、 $L^2$ は脱離基を示す。)で表される化合物またはその塩と反応させて、式



(I-a-1b)

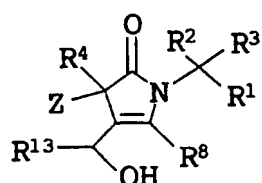
または



(I-b-1b)

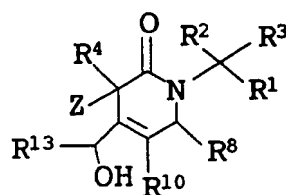
(式中、 $R^{13}$ 及び $R^{14y}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(8) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物またはその塩を還元剤と反応させて、式



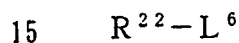
(I-a-1c)

または

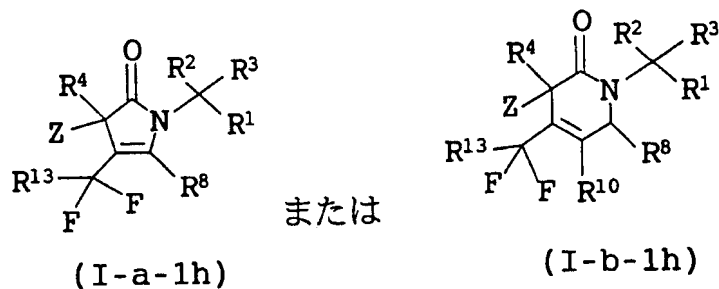


(I-b-1c)

(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-a-1c)または(I-b-1c)で表される化合物またはその塩を式

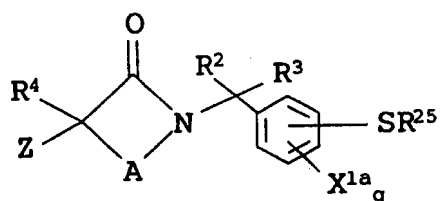


(式中、 $R^{22}$ はそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基または(ii)  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を、 $L^6$ は脱離基を示す。)で表される化合物またはその塩と反応させて、式



(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(11) 式

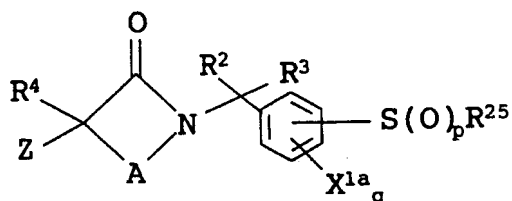


(I-e)

5

(式中、 $R^{25}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基またはフェニル基を、 $q$ は0～2の整数を、 $X^{1a}$ は同一または異なってハロゲン原子またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式

10

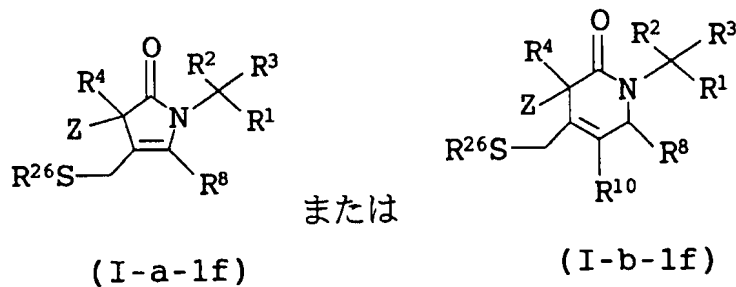


(I-e')

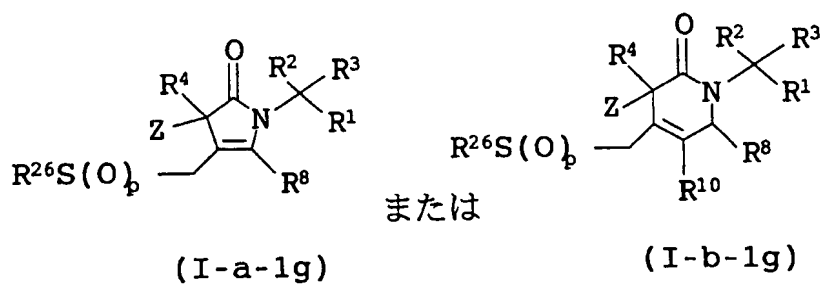
(式中、 $p$ は1または2を、 $R^{25}$ 、 $X^{1a}$ 及び $q$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

15

(12) 式

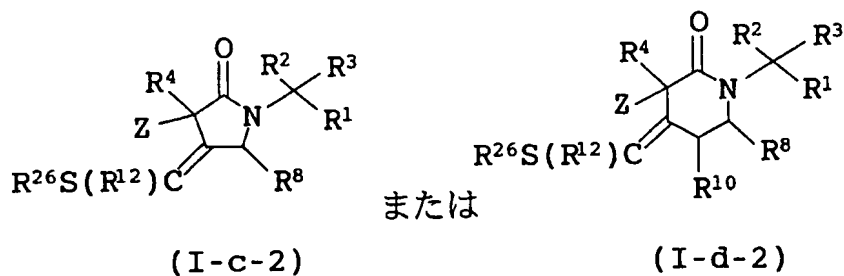


(式中、 $R^{26}$ は $C_{1-6}$ アルキル基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式

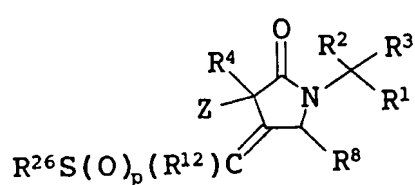


- 5 (式中、 $R^{26}$ 及び $p$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(13) 式

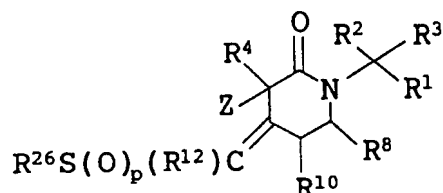


- 10 (式中、 $R^{26}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式



(I-c-3)

または

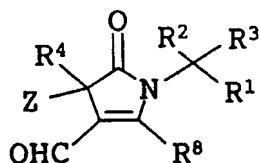


(I-d-3)

(式中、 $R^{26}$ 及び $p$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

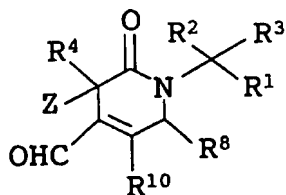
5

(14) 式



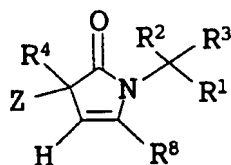
(I-a-2a')

または



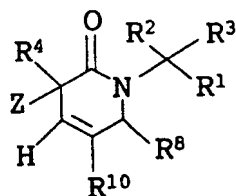
(I-b-2a')

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を有機ロジウム錯体と反応させて、式



(I-a-1i)

または

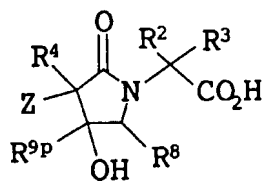


(I-b-1i)

10

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

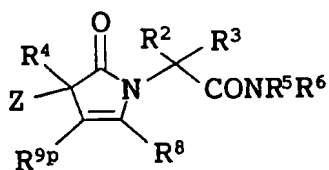
(15) 式



(II'-a-1)

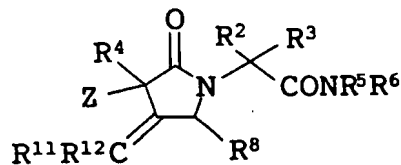
(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、式  $HNR^5R^6$

- 5 (式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩と反応させて、式



(I-a-1r)

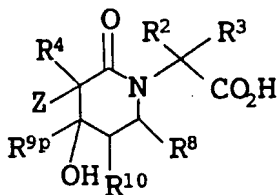
及び/または



(I-c-r)

- 10 (式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(16) 式

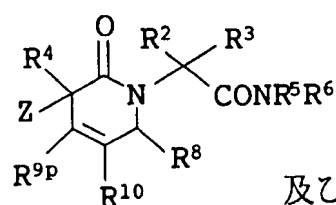


(II'-b-1)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、式

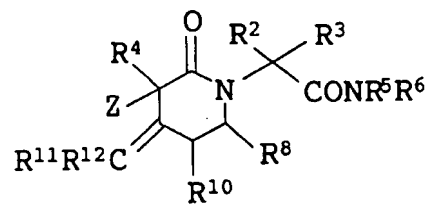
- 15  $HNR^5R^6$

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩と反応させて、式



(I-b-1r)

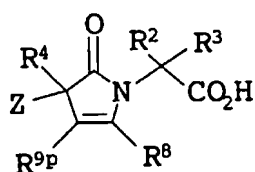
及び/または



(I-d-r)

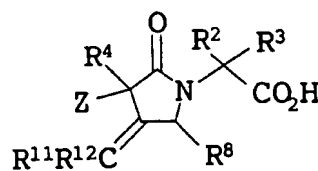
(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(17) 式



(I'-a-1)

または



(I'-c-1)

5

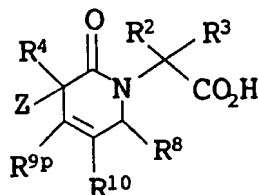
(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、得られる酸ハロゲン化物と、式



10

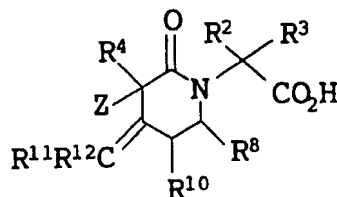
(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩とを反応させて、上記(15)に記載の式(I-a-1r)または(I-c-r)で表される化合物またはその塩を製造するか、または

(18) 式



(I'-b-1)

または



(I'-d-1)

15

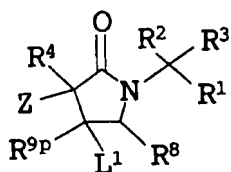
(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、得られる酸ハロゲン化物と、式

$\text{HNR}^5\text{R}^6$

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩とを反応させて、上記〔16〕に記載の式 (I-b-1r) または (I-d-r) で表される化合物またはその塩を製造することを特徴とする上記〔1〕項記載の化合物またはその塩の製造法、

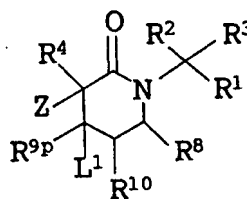
5

〔20〕式



(II-a-1x)

または



(II-b-1x)

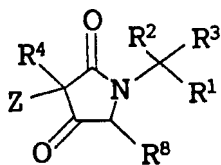
(式中、 $\text{R}^{9p}$ は上記〔19〕項記載と同意義を、 $\text{L}^1$ はハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $-\text{OS}(\text{O})\text{Cl}$ または式

10

$-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^{18}$

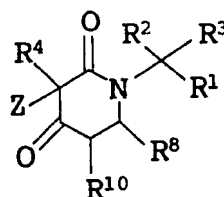
(式中、 $\text{R}^{18}$ は置換されていてもよい炭化水素基を示す。) で表される基を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩、

〔21〕式



(II-a-3)

または

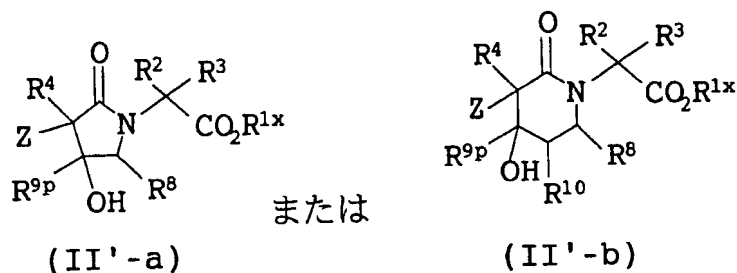


(II-b-3)

15

(式中、各記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩、

〔22〕式



(式中、 $R^{1x}$ は水素原子、ベンジル基またはtert-ブチル基を、 $R^{9p}$ は上記〔19〕項記載と同意義を、その他の記号は上記〔1〕項記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩、

- 5   〔23〕上記〔1〕項記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする除草剤、
- 〔24〕水田用除草剤である上記〔23〕項記載の除草剤、
- 〔25〕上記〔1〕項記載の化合物の除草剤としての使用、
- 〔26〕上記〔1〕項記載の化合物またはその塩を水田に施用することを特徴とする水田雑草の除草方法、
- 10   〔27〕上記〔1〕項記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする水面浮遊性粒剤、
- 〔28〕さらに結合剤、界面活性剤及び比重が1以下の粉末基剤を含有することを特徴とする上記〔27〕項記載の水面浮遊性粒剤、
- 15   〔29〕結合剤が、カルボキシメチルセルロースまたはその塩及びポリカルボン酸系高分子化合物またはその塩から選ばれる1種以上である上記〔28〕項記載の水面浮遊性粒剤、
- 〔30〕界面活性剤が、アルキルスルホサクシネートまたはアセチレングリコール系界面活性剤より選ばれる1種以上である上記〔28〕項記載の水面浮遊性粒剤、
- 20   〔31〕比重が1以下の粉末基剤が、パーライトである上記〔28〕項記載の水面浮遊性粒剤、
- 〔32〕さらに有機溶剤を含有することを特徴とする上記〔27〕項記載の水面浮遊性粒剤、



〔33〕有機溶剤が、メチルナフタレンである上記〔32〕項記載の水面浮遊性粒剤、

〔34〕さらに他の除草活性成分を含有することを特徴とする上記〔27〕項記載の水面浮遊性粒剤、

5 〔35〕他の除草活性成分がイマゾスルフロンのである上記〔34〕項記載の水面浮遊性粒剤、

〔36〕20ないし200g単位で水溶性フィルムで包装した上記〔27〕項記載の水面浮遊性粒剤、

10 〔37〕上記〔1〕項記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする水性懸濁剤、

〔38〕さらに界面活性剤を含有することを特徴とする上記〔37〕項記載の水性懸濁剤、

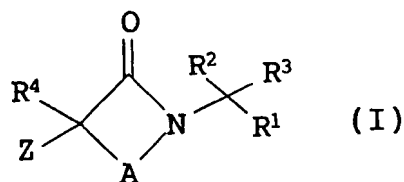
15 〔39〕界面活性剤が、アルキルスルホサキシネート及びポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩から選ばれる1種以上である上記〔38〕項記載の水性懸濁剤、

〔40〕さらに他の除草活性成分を含有することを特徴とする上記〔37〕項記載の水性懸濁剤および

〔41〕他の除草活性成分がイマゾスルフロンのである上記〔40〕項記載の水性懸濁剤に関する。

20 さらに、別の態様として本発明は

〔42〕一般式



〔式中、R<sup>1</sup>は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式

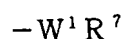
25  $-\text{CONR}^5\text{R}^6$

〔式中、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基ま

たは置換されていてもよい複素環基を示す。) で表される基を示し、

$R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示すか、または  $R^2$  及び  $R^3$  は隣接する炭素原子と一緒に置換されていてもよい3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、

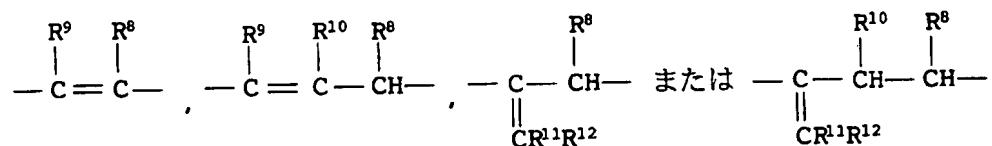
- 5  $R^4$  は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $W^1$  は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $R^7$  は置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。) で表

- 10 される基を示し、

$-A-$  は式



(式中、 $R^8$  は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、 $R^9$  は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基または式

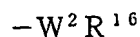
- 15



(式中、 $R^{15}$  は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。) で表される基を示し、

$R^{10}$  は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、

- 20  $R^{11}$  は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $W^2$  は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $R^{16}$  は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示す。) で表される基を示し、

- 25

$R^{12}$  は水素原子、ハロゲン原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、

ここで、 $R^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $R^9$ または $=C$   
 $R^{11}R^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。)で表され  
る基を示し、

5 Zはハロゲン原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基または置換さ  
れていてもよいアシル基を示す。]で表される化合物またはその塩、

[43]  $R^1$ は[1] $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニ  
ル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$   
アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水  
素基(該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該  
10 炭化水素基は、

- (1) ヒドロキシ基、
- (2) アミノ基、
- (3) シアノ基、
- (4) スルファモイル基、
- 15 (5) スルファモイルオキシ基、
- (6) メルカプト基、
- (7) ニトロ基、
- (8) ハロゲン原子、
- (9) ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロア  
20 ルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$   
アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、  
 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ  
基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、  
 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ ア  
25 リールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ  
ルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$   
アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル  
スルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換さ  
れていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、

C<sub>2-6</sub>アルキニルスルホニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルチオ基およびC<sub>6-14</sub>アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基、

(10)ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシカルボニル基、5~6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5~6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ニトロ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1~3個置換されていてもよく、

該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5~6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5~6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシカルボニル基、5~6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5~6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ニトロ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1~3個置換されていてもよく、

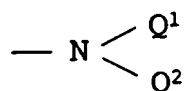
シーカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよい。)

- 5 (II)式-T-Q<sup>0</sup>〔式中、Q<sup>0</sup>は(a)ハロゲンで1~5個置換されていてもよい  
 (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、  
 (iv)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(v)  $C_{6-14}$ アリール基、(vi)  $C_{7-19}$ アラルキル基、  
 (vii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基  
 から選ばれる炭化水素基、(b)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$
- 10 アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル  
 基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換され  
 ていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニ  
 ルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミ  
 ル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-}$
- 15  $_6$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$   
 アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロ  
 ゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$   
 アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリ  
 ールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル
- 20 スルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル  
 基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-}$   
 $_6$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプ  
 ト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキ  
 ルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ ア
- 25 リールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよ  
 く、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成し  
 てもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子  
 （モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1な  
 いし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは

は窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)を、TはO、 $-S(O)_k-$ （kは0、1または2を示す）またはS-Sを示す]で表される基、

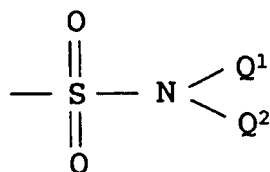
(12)式



〔式中、 $Q^1$ は(a)水素原子、(b)ハロゲンで1～5個置換されていてもよい(i) $C_{1-6}$ アルキル基、(ii) $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii) $C_{2-6}$ アルケニル基、

(iv)  $C_{2-6}$  アルキニル基, (v)  $C_{6-14}$  アリール基, (vi)  $C_{7-19}$  アラルキル基,  
 (vii)  $C_{8-20}$  アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$  アリールアルキニル基  
 から選ばれる炭化水素基または(c)ホルミル, ハロゲンで1~5個置換されて  
 いてもよい $C_{1-6}$  アルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$  アリール-カルボニル基,  
 5  $C_{1-6}$  アルコキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$  アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$  アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$  アラルキルオキシ-カルボニル基,  
 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5~6員複素環  
 アセチル基から選ばれるアシル基を、 $Q^2$ は(a)ハロゲンで1~5個置換されて  
 いてもよい(i)  $C_{1-6}$  アルキル基, (ii)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基, (iii)  $C_{2-6}$  ア  
 10 ルケニル基, (iv)  $C_{2-6}$  アルキニル基, (v)  $C_{6-14}$  アリール基, (vi)  $C_{7-19}$  ア  
 ラルキル基, (vii)  $C_{8-20}$  アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$  アリール  
 アルキニル基から選ばれる炭化水素基または(b)ホルミル, ハロゲンで1~5  
 個置換されていてもよい $C_{1-6}$  アルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$  アリール-カ  
 ルボニル基,  $C_{1-6}$  アルコキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$  アリールオキシ-カル  
 15 ボニル基,  $C_{7-19}$  アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$  アラルキルオキシ-カ  
 ルボニル基, 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5  
 ~6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基を示すか、または $Q^1$ および $Q^2$   
 は隣接する窒素原子とともに3ないし7員環を形成してもよい。) で表される  
 基、

20 (13) 式



〔式中の記号は前記と同意義を示す〕で表される基、

(14) (a) (i)  $C_{1-6}$  アルキル基, (ii)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基, (iii)  $C_{2-6}$  アル  
 ケニル基, (iv)  $C_{2-6}$  アルキニル基, (v)  $C_{6-14}$  アリール基, (vi)  $C_{7-19}$  アラ  
 25 ルキル基, (vii)  $C_{8-20}$  アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$  アリールア  
 ルキニル基から選ばれる炭化水素基, (b) ハロゲンで1~3個置換されていて

もよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5~6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5~6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カル



ボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

- 5      該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)で1ないし2個
- 10      置換されていてもよいカルバモイル基、
- 15      (15) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(v)  $C_{6-14}$ アリール基、(vi)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(vii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい
- 20
- 25

$C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい

5  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

10  
15  
20

該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ ア

25

- リールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)で1ないし2個
- 5 置換されていてもよいカルバモイルオキシ基、
- (16) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(v)  $C_{6-14}$ アリール基、(vi)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(vii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～
- 10 3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい
- 15  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベ
- 20
- 25

ンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。）で1ないし2個置換されていてもよいウレイド基、

(17) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(v)  $C_{6-14}$ アリール基、(vi)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(vii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b) ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$

-<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基、C<sub>7-19</sub>アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルフィニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルスルホニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルチオ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルチオ基およびC<sub>6-14</sub>アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基またはアルコキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ニトロ

基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてよく、

5 該アシル基がアリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてよい。)で1ないし2個置換されていてよいチオカルバモイル基、

15 (18)カルボキシ基、

(19)式 $-O-SO_2-Q^2$ 〔式中、 $Q^2$ は前記と同意義を示す〕で表される基、

(20)スルホ基および

(21)式 $=N-OR^{14}$ 〔式中、 $R^{14}$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基またはハロゲンで1～3個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基を示す〕で  
20 表される基からなる群(以下、置換基群(A))から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてよい。

上記炭化水素基がシクロアルキル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1  
25 ～5個置換されていてよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、

[2]ハロゲンで1～3個置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロ

- アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または

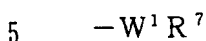
[3]式



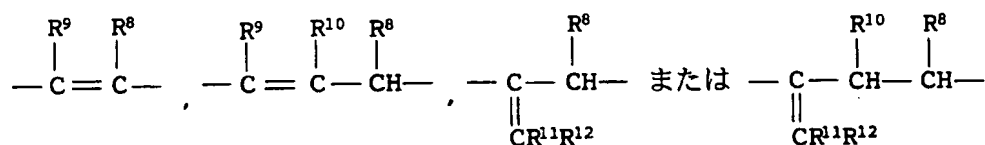
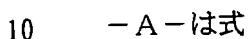
- 25 (式中、 $R^5$ 及び $R^6$ はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）または置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）を示す。）で表される基を示し、  
 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ水素原子または上記置換基群（A）から選ばれる置換基で1～4個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示すか、または $R^2$ 及び $R^3$

は隣接する炭素原子と一緒にハロゲンで1～3個置換されていてもよい3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、

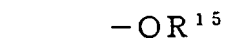
$R^4$ は置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）、置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）または式



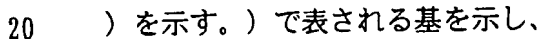
（式中、 $W^1$ は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫黄原子を、 $R^7$ は置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）または置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）を示す。）で表される基を示し、



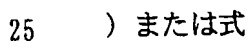
（式中、 $R^8$ は水素原子または上記置換基群（A）から選ばれる置換基で1～4個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示し、 $R^9$ は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）、置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）、置換されていてもよいアシル基（上記[1]の(10)と同意義を示す。）、または式



（式中、 $R^{15}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）または置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）を示す。）で表される基を示し、



$R^{11}$ は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）、置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）





(式中、 $W^2$ は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫黄原子を、 $R^{16}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基（上記[1]と同意義を示す。）、置換されていてもよい複素環基（上記[2]と同意義を示す。）または置換されていてもよいアシル基（上記[1]の(10)と同意義を示す。）を示す。

5 )で表される基を示し、

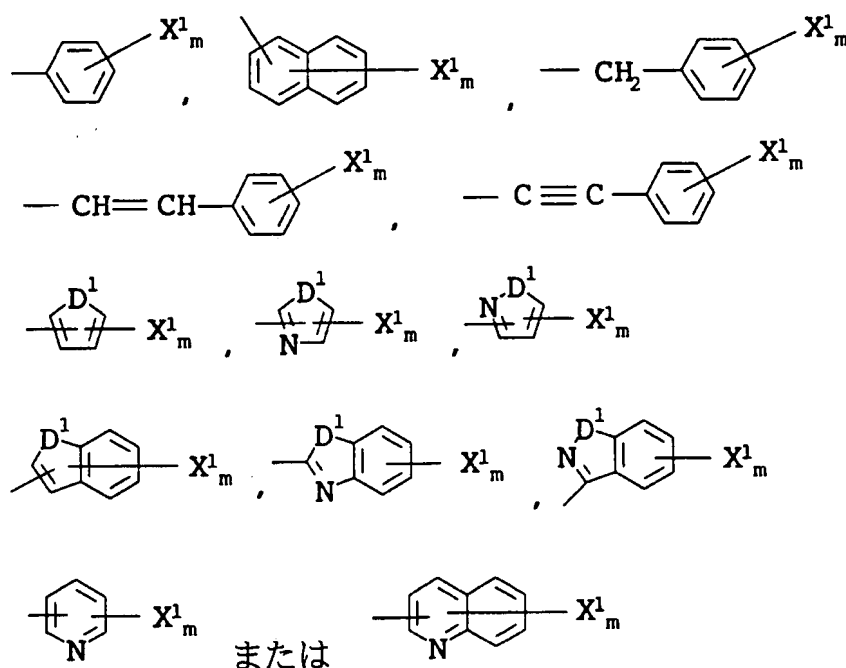
$R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子または上記置換基群(A)から選ばれる1~4個の置換基で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示し、

ここで、 $R^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $R^9$ または $=CR^{11}R^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。)で表

10 される基を示し、

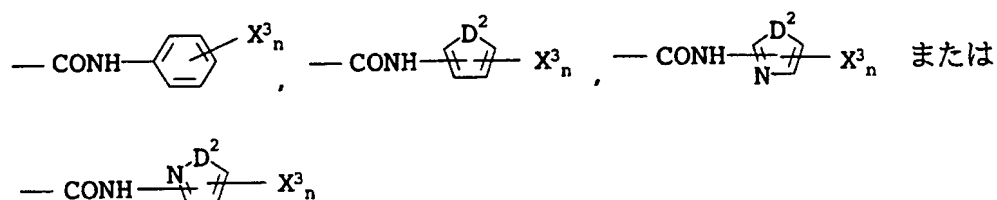
Zはハロゲン原子、シアノ基、上記置換基群(A)から選ばれる1~4個の置換基で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または置換されていてもよいアシル基（上記[1]の(10)と同意義を示す。）を示す上記[42]項記載の化合物またはその塩、

15 [44]  $R^1$ が式



[式中、 $X^1$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換され

- ていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基、
- 5 ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、アミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、
- 10 または $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基を示すか、隣接する2つの $X^1$ が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよく、 $m$ は0～3の整数を示し、 $D^1$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d1}$  (式中、 $R^{d1}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される基を示す。) で表される基、または式
- 15

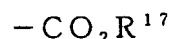


- [式中、 $X^3$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、フェノキシ基、シアノ基、またはニトロ基を、 $n$ は0～3の整数を、 $D^2$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d2}$  (式中、 $R^{d2}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される基を示す。]で表される基である上記〔42〕項記載の化合物またはその塩、
- 20
- 25 [45]  $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$

アルキル基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

〔４６〕 $R^4$ が(i)ハロゲン原子、ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基およびハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基から選ばれる１～３個の置換基で置換されていてもよい(i)フェニル基、(ii)ナフチル基または(iii)チエニル基、(2)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(3)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、(4)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、または(5)ハロゲンで１～３個置換されていてもよいフェノキシ基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

〔４７〕 $Z$ がハロゲン原子、シアノ基、または式



[式中、 $R^{17}$ は(i)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(2)(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(iii)ハロゲンで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基で１～３個置換されていてもよい $C_{7-19}$ アラルキル基を示す。]で表される基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

〔４８〕 $R^8$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

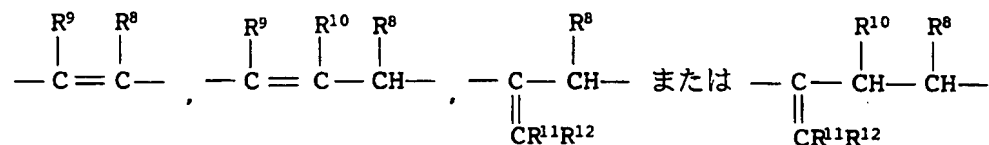
〔４９〕 $R^9$ が(i)水素原子、(2)(i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ基、(iii) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(iv) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(v) $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(vi) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(vii) $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基または(viii)式 $=N-OR^{14}$ [式中、 $R^{14}$ は上記〔４３〕項記載と同意義を示す。]で表される基で１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、(3) $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(4) $C_{2-6}$ アルケニル基、(5) $C_{1-6}$ アルコキシで１～３個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(6)シアノ基、(7)ホルミル基または(8)ヒドロキシ基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

〔５０〕 $R^{10}$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基である上記〔４２〕項記載の化合物またはその塩、

〔５１〕 $R^{11}$ および $R^{12}$ がそれぞれ水素原子、ハロゲン原子またはハロゲンで

1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基である上記〔42〕項記載の化合物またはその塩、および

- 〔52〕R<sup>1</sup>は(i)ハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基もしくはC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基で1～3個置換されていてもよい(ii)フェニル基もしくは(iii)ナフチル基または(2)ハロゲンもしくはハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基で1～3個置換されていてもよいフェニルで1もしくは2個置換されていてもよいカルバモイル基を、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>4</sup>はハロゲンで1～3個置換されていてもよいフェニル基またはC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を、-A-は式



- (式中、R<sup>8</sup>は(i)水素原子または(ii)C<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>9</sup>は(i)ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルオキシ、ヒドロキシイミノ、C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノもしくはアセトキシイミノで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、(ii)C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、(iii)C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(iv)C<sub>1-6</sub>アルコキシで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(v)ホルミル基、(vi)シアノ基または(vii)ヒドロキシ基を、R<sup>10</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>11</sup>およびR<sup>12</sup>はそれぞれ水素原子を示す。)
- で表される基を、Zは(i)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基または(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基を示す上記〔42〕項記載の化合物またはその塩に関する。

発明を実施するための最良の形態

- なお上記一般式(I)で表される化合物が1個以上の不斉中心を有する場合、一般式(I)で表される化合物には2個以上の立体異性体(例えば、エナンチオ

マー、ジアステレオマー等)が存在するが、一般式(I)にはこれらの立体異性体のすべて及びそれらのうちの任意の2個以上からなる混合物が包含されている。

また上記一般式(I)で表される化合物が二重結合等に関する幾何異性を有する場合、一般式(I)で表される化合物には2個以上の幾何異性体(例えば、E/Zまたはトランス/シスの各異性体、S-トランス/S-シスの各異性体等)が  
5 存在するが、一般式(I)にはこれらの幾何異性体のすべて及びそれらのうちの任意の2個以上からなる混合物が包含されている。

R<sup>1</sup>で示される置換されていてもよい炭化水素基における炭化水素基としては、直鎖、分枝状または環状の二重結合もしくは三重結合を有することもできる脂肪族基、アリール基またはアラルキル基などが挙げられる。具体的には、  
10 アルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、シクロアルケニル基、アルキニル基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール-アルキニル基などが挙げられる。

該アルキル基としては、好ましくは炭素数1から6の直鎖もしくは分枝状アルキル基が挙げられ、例えばメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、sec-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、イソヘキシル等のC<sub>1-6</sub>アルキル基等が用いられる。  
15

該シクロアルキル基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルキル基が挙げられ、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が用いられる。  
20

該アルケニル基としては、好ましくは炭素数2から6の直鎖もしくは分枝状のアルケニル基が挙げられ、例えばアリル、イソプロペニル、イソブテニル、1-メチルアリル、2-ペンテニル、2-ヘキセニルなどのC<sub>2-6</sub>アルケニル等が用いられる。  
25

該シクロアルケニル基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルケニル基が挙げられ、例えば1-もしくは2-シクロプロペニル、1-もしくは2-シクロブテニル、1-、2-もしくは3-シクロペンテニル、1-、2-もしくは3-シクロヘキセニルなどのC<sub>3-6</sub>シクロアルケニル等が用いられる。

該アルキニル基としては、好ましくは炭素数 2 から 6 のアルキニル基が挙げられ、例えばプロパルギル、2-ブチニル、3-ブチニル、3-ペンチニル、3-ヘキシニル等の  $C_{2-6}$  アルキニル基等が用いられる。

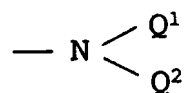
該アリール基としては、好ましくは炭素数 6 から 14 のアリール基が挙げられ、例えばフェニル、ナフチル、アンスリル等が用いられる。

該アラルキル基としては、好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキル基が挙げられ、例えばベンジル、フェネチル、フェニルプロピルなどのフェニル- $C_{1-4}$  アルキル、ベンズヒドリル、トリチル等が用いられる。

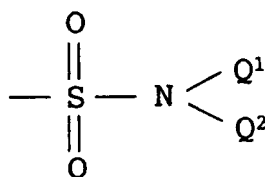
該アリール-アルケニル基としては、好ましくは炭素数 8 から 20 のアリール-アルケニル基が挙げられ、例えば、スチリル、シンナミルなどの  $C_{6-14}$  アリール- $C_{2-6}$  アルケニル等が用いられる。

該アリール-アルキニル基としては、好ましくは炭素数 8 から 20 のアリール-アルキニル基が挙げられ、例えば、フェニルエチニルなどの  $C_{6-14}$  アリール- $C_{2-6}$  アルキニル等が用いられる。

該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、例えば、ヒドロキシ基、アミノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルファモイルオキシ基、メルカプト基、ニトロ基、ハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基、式  $-T-Q^0$  [式中、 $Q^0$  は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を、 $T$  は  $O$ 、 $-S(O)_k-$  ( $k$  は 0, 1 または 2 を示す) または  $S-S$  を示す] で表される基、式



[式中、 $Q^1$  は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよいアシル基を、 $Q^2$  は置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよいアシル基を示すか、または  $Q^1$  および  $Q^2$  は隣接する窒素原子とともに環を形成してもよい。] で表される基、式



- 〔式中の記号は前記と同意義を示す〕で表される基、置換されていてもよいカルバモイル基、置換されていてもよいカルバモイルオキシ基、置換されていてもよいウレイド基、置換されていてもよいチオカルバモイル基、カルボキシル基、式 $-\text{O}-\text{SO}_2-\text{Q}^2$ 〔式中、 $\text{Q}^2$ は前記と同意義を示す〕で表される基、スルホ基、式 $=\text{N}-\text{OR}^{14}$ 〔式中、 $\text{R}^{14}$ は水素原子、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基（例、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル等）またはハロゲン（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基（例、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル等）を示す〕で表される基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基（例、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等）等からなる群（以下、置換基群（A'））（好ましくは上記置換基群（A））から選ばれる同一または異なる1～4個の置換基で置換されていてもよい。

- 上記炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラールキル基、アリール-アルケニル基またはアリール-アルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A'）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個（好ましくは1～3個）置換されていてもよいアルキル基（例、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $n$ -ブチル、イソブチル、 $sec$ -ブチル、 $tert$ -ブチル、 $n$ -ペンチル、 $sec$ -ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、 $n$ -ヘキシル、イソヘキシル、トリフルオロメチル等の $\text{C}_{1-6}$ アルキル基やハロ $\text{C}_{1-6}$ アルキル基）、シクロアルキル基（例、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基）、アルケニル基（例、アリル、イソプロペニル、イソプテニル、1-メチルアリル、2-ペンテニル、2-ヘキセニルなどの $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基）、シクロアルケニル基（例、1-もしくは2-シクロプロペニル、1-もしくは2-シクロブテニル、1-、2-もしくは3-シクロペンテニル、1-、2-もしくは3-シクロヘ

キセニルなどの $C_{3-6}$ シクロアルケニル基)、アルキニル基(例、プロパルギル、2-ブチニル、3-ブチニル、3-ペンチニル、3-ヘキシニル等の $C_{2-6}$ アルキニル基)、アリール基(例、フェニル、ナフチル等の $C_{6-14}$ アリール基)、アラルキル基(例、ベンジル、フェネチル等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキルなどの $C_{7-19}$ アラルキル基など)などで1~5個(好ましくは1~3個)置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。

上記置換基群(A')における置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基、 $Q^0$ で示される置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基および $Q^1$ または $Q^2$ で示される置換されていてもよいアシル基は下記で詳しく説明される。

$Q^0$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ で示される炭化水素基としては上記 $R^1$ で示される置換されていてもよい炭化水素基における炭化水素基と同様のものが挙げられる。

$Q^0$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ で示される炭化水素基は置換基として1~5個(好ましくは1~3個)のハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)を有していてもよい。

上記置換基群(A')におけるカルバモイル基、カルバモイルオキシ基、ウレイド基またはチオカルバモイル基は、炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基で1ないし2個同一または異なって置換されていてもよい。該炭化水素基としては上記 $R^1$ で示される置換されていてもよい炭化水素基における炭化水素基と同様のものが挙げられる。該置換されていてもよい複素環基および置換されていてもよいアシル基は以下に詳しく説明される。

本願明細書において置換されていてもよい複素環基における複素環基としては、例えば、窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子、硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)などのヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基(好ましくは5~6員複素環基)または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子、硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)などのヘテロ原



子を1ないし4個含む3～8員複素環（好ましくは5～6員複素環）とが縮合して形成する基を示す。

具体的には、アジリジニル（例、1－または2－アジリジニル）、アジリニル（例、1－または2－アジリニル）、アゼチル（例、2－、3－または4－アゼチル）、アゼチジニル（例、1－、2－または3－アゼチジニル）、パーヒドロアゼピニル（例、1－、2－、3－または4－パーヒドロアゼピニル）、パーヒドロアゾシニル（例、1－、2－、3－、4－または5－パーヒドロアゾシニル）、ピロリル（例、1－、2－または3－ピロリル）、ピラゾリル（例、1－、3－、4－または5－ピラゾリル）、イミダゾリル（例、1－、2－、4－または5－イミダゾリル）、トリアゾリル（例、1、2、3－トリアゾール－1－、4－または5－イル、1、2、4－トリアゾール－1－、3－、4－または5－イル）、テトラゾリル（例、テトラゾール－1－、2－または5－イル）、フリル（例、2－または3－フリル）、チエニル（例、2－または3－チエニル）、硫黄原子が酸化されたチエニル（例、2－または3－チエニル－1、1－ジオキシド）、オキサゾリル（例、2－、4－または5－オキサゾリル）、イソキサゾリル（例、3－、4－または5－イソキサゾリル）、オキサジアゾリル（例、1、2、3－オキサジアゾール－4－または5－イル、1、2、4－オキサジアゾール－3－または5－イル、1、2、5－オキサジアゾール－3－イル、1、3、4－オキサジアゾール－2－イル）、チアゾリル（例、2－、4－または5－チアゾリル）、イソチアゾリル（例、3－、4－または5－イソチアゾリル）、チアジアゾリル（例、1、2、3－チアジアゾール－4－または5－イル、1、2、4－チアジアゾール－3－または5－イル、1、2、5－チアジアゾール－3－イル、1、3、4－チアジアゾール－2－イル）、ピロリジニル（例、1－、2－または3－ピロリジニル）、ピリジル（例、2－、3－または4－ピリジル）、窒素原子が酸化されたピリジル（例、2－、3－または4－ピリジル－N－オキシド）、ピリダジニル（例、3－または4－ピリダジニル）、窒素原子の一方または両方が酸化されたピリダジニル（例、3－、4－、5－または6－ピリダジニル－N－オキシド）、ピリミジニル（例、2－、4－または5－ピリミジニル）、窒素原

子的一方または両方が酸化されたピリミジニル（例、2-、4-、5-または6-ピリミジニル-N-オキシド）、ピラジニル、ピペリジニル（例、1-、2-、3-または4-ピペリジニル）、ピペラジニル（例、1-または2-ピペラジニル）、インドリル（例、3H-インドール-2-、3-、4-、5-、6-または7-イル）、ピラニル（例、2-、3-または4-ピラニル）、チオピラニル（例、2-、3-または4-チオピラニル）、硫黄原子が酸化されたチオピラニル（例、2-、3-または4-チオピラニル-1,1-ジオキシド）、モルホリニル（例、2-、3-または4-モルホリニル）、チオモルホリニル、キノリル（例、2-、3-、4-、5-、6-、7-または8-キノリル）、イソキノリル（例、1-、3-、4-、5-、6-、7-または8-イソキノリル）、ピリド〔2,3-d〕ピリミジニル（例、ピリド〔2,3-d〕ピリミジン-2-イル）、1,5-、1,6-、1,7-、1,8-、2,6-または2,7-ナフチリジニルなどのナフチリジニル（例、1,5-ナフチリジン-2-または3-イル）、チエノ〔2,3-d〕ピリジニル（例、チエノ〔2,3-d〕ピリジン-3-イル）、ピラジノキノリル（例、ピラジノ〔2,3-b〕キノリン-2-イル）、クロメニル（例、2H-クロメン-2-または3-イル）、イミダゾ〔1,2-a〕ピリジニル（例、イミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-イル）、キナゾリニル（例、キナゾリン-2-イル）、1,4-ジオキシニル、1,4-ベンゾジオキシニル（例、1,4-ベンゾジオキシニン-2-または6-イル）、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル（例、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニン-6-イル）、ベンゾフラニル（例、3-または5-ベンゾフラニル）、ベンゾチエニル（例、3-または5-ベンゾチエニル）などが用いられる。

該複素環基は、ハロゲン（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で1~3個置換されていてもよいアルキル基（例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、sec-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、イソヘキシル等のC<sub>1-6</sub>アルキル）、シクロアルキル基（例、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC<sub>3-6</sub>シクロアルキル）、アルケニル基

(例、アリル、イソプロペニル、イソブテニル、1-メチルアリル、2-ペン  
テニル、2-ヘキセニルなどの $C_{2-6}$ アルケニル)、シクロアルケニル基(例、  
シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルな  
5    どの $C_{3-6}$ シクロアルケニル)、アルキニル基(例、プロパルギル、2-ブチ  
ニル、3-ブチニル、3-ペンチニル、3-ヘキシニル等の $C_{2-6}$ アルキニ  
ル)、アリール基(例、フェニル、ナフチル等の $C_{6-14}$ アリール)、アラ  
ルキル基(例、ベンジル等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキルなどの $C_{7-19}$ アラ  
ルキル)、ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されてい  
てもよいアルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*tert*-ブ  
10    トキシ、*n*-ヘキシルオキシ等の $C_{1-6}$ アルコキシ)、アルケニルオキシ基(例、  
アリルオキシ、イソプロペニルオキシ、イソブテニルオキシ、1-メチルアリ  
ルオキシ、2-ペンテニルオキシ、2-ヘキセニルオキシなどの $C_{2-6}$ アルケ  
ニルオキシ)、アルキニルオキシ基(例、プロパルギルオキシ、2-ブチニル  
オキシ、3-ブチニルオキシ、3-ペンチニルオキシ、3-ヘキシニルオキシ  
15    等の $C_{2-6}$ アルキニルオキシ)、アリールオキシ(例、フェノキシ等の $C_{6-14}$   
アリールオキシ)、アラルキルオキシ基(例、ベンジルオキシ等のフェニル-  
 $C_{1-4}$ アルキルオキシなどの $C_{7-19}$ アラルキルオキシ)、アシル基〔例、ホル  
ミル、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル(例、アセチル、プロピオニル、ブチリル、  
イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル等)、 $C_{2-6}$ アル  
20    ケニル-カルボニル(例、アリルカルボニル、イソプロペニルカルボニル、イ  
ソブテニルカルボニル、1-メチルアリルカルボニル、2-ペンテニルカルボ  
ニル、2-ヘキセニルカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基(例、  
プロパルギルカルボニル、2-ブチニルカルボニル、3-ブチニルカルボニル、  
3-ペンチニルカルボニル、3-ヘキシニルカルボニル等)、 $C_{3-6}$ シクロア  
25    ルキル-カルボニル基(例、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボ  
ニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等)、 $C_{6-14}$   
アリール-カルボニル(例、ベンゾイル、ナフタレンカルボニル等)、 $C_{1-6}$   
アルコキシ-カルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プ  
ロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソ

プトキシカルボニル、sec-プトキシカルボニル、tert-プトキシカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基(例、アリルオキシカルボニル、イソプロペニルオキシカルボニル、イソブテニルオキシカルボニル、1-メチルアリルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル、2-ヘキセニルオキシカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基(例、プロパルギルオキシカルボニル、2-ブチニルオキシカルボニル、3-ブチニルオキシカルボニル、3-ペンチニルオキシカルボニル、3-ヘキシニルオキシカルボニル等)、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基(例、シクロプロピルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニル、シクロヘキシルオキシカルボニル等)、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル(例、フェノキシカルボニル等)、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル(例、ベンジルカルボニル、フェネチルカルボニル、フェニルプロピルカルボニルなどのフェニル- $C_{1-4}$ アルキルカルボニル等)、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル(例、ベンジロキシカルボニルなどのフェニル- $C_{1-4}$ アルキルオキシカルボニル等)等]、ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいアルキルスルフィニル基(例、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル等の $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル)、アルケニルスルフィニル基(例、アリルスルフィニル、イソプロペニルスルフィニル、イソブテニルスルフィニル等の $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル)、アルキニルスルフィニル(例、プロパルギルスルフィニル、2-ブチニルスルフィニル、3-ブチニルスルフィニル等の $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル)、アリールスルフィニル基(例、フェニルスルフィニル等の $C_{6-14}$ アリールスルフィニル)、ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいアルキルスルホニル基(例、メチルスルホニル、エチルスルホニル等の $C_{1-6}$ アルキルスルホニル)、アルケニルスルホニル基(例、アリルスルホニル、イソプロペニルスルホニル、イソブテニルスルホニル等の $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル)、アルキニルスルホニル(例、プロパルギルスルホニル、2-ブチニルスルホニル、3-ブチニルスルホニル等の $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル)、アリールスルホニル基(例、フェニルスルホニル等の $C_{6-14}$

アリールスルホニル), ニトロ基, アミノ基, モノもしくはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基 (例、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチルエチルアミノ等), ヒドロキシ基, シアノ基, スルファモイル基, メルカプト基, ハロゲン原子 (例、フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素), ホルムアミド基, C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルアミノ基 (例、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、ヘプタノイルアミノ等), C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基 (例、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ等), ハロゲン (例、フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素) で1~3個置換されていてもよいアルキルチオ基 (例、メチルチオ, エチルチオ, n-プロピルチオ, イソブチルチオ等のC<sub>1-6</sub>アルキルチオ), アルケニルチオ基 (例、アリルチオ, イソプロペニルチオ, イソブテニルチオ等のC<sub>2-6</sub>アルケニルチオ), アルキニルチオ基 (例、プロパルギルチオ, 2-ブチニルチオ, 3-ブチニルチオ等のC<sub>2-6</sub>アルキニルチオ) およびアリールチオ基 (例、フェニルチオ等のC<sub>6-14</sub>アリールチオ) からなる群から選ばれる同一または異なる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。

本願明細書において置換されていてもよいアシル基におけるアシル基とは、有機カルボン酸から誘導される炭素数1から20のアシル基を示す。例えば、アルカノイル基, 好ましくは炭素数1から7のアルカノイル基 (例、ホルミルまたはアセチル, プロピオニル, ブチリル, イソブチリル, ペンタノイル, ヘキサノイル, ヘプタノイル等のC<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基等), アルケニルカルボニル基, 好ましくは炭素数2から6のアルケニル-カルボニル基 (例、アリルカルボニル, イソプロペニルカルボニル, イソブテニルカルボニル, 1-メチルアリルカルボニル, 2-ペンテニルカルボニル, 2-ヘキセニルカルボニル等), アルキニルカルボニル基, 好ましくは炭素数2から6のアルキニル-カルボニル基 (例、プロパルギルカルボニル, 2-ブチニルカルボニル, 3-ブチニルカルボニル, 3-ペンチニルカルボニル, 3-ヘキシニルカルボニル等), シクロアルキルカルボニル基, 好ましくは炭素数3から6のシクロアルキル-カルボニル基 (例、シクロプロピルカルボニル, シクロブチルカル

ポニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等), アリー  
ルカルボニル基, 好ましくは炭素数 6 から 14 のアリール-カルボニル基 (例、  
ベンゾイル, ナフタレンカルボニル等), アルコキシカルボニル基, 好ましく  
は炭素数 1 から 6 のアルコキシ-カルボニル基 (例、メトキシカルボニル, エ  
5 トキシカルボニル, プロポキシカルボニル, イソプロポキシカルボニル, ブト  
キシカルボニル, イソブトキシカルボニル, sec-ブトキシカルボニル, tert  
-ブトキシカルボニル等), アルケニルオキシカルボニル基, 好ましくは炭素  
数 2 から 6 のアルケニルオキシ-カルボニル基 (例、アリルオキシカルボニル,  
イソプロペニルオキシカルボニル, イソブテニルオキシカルボニル, 1-メチ  
10 ルアリルオキシカルボニル, 2-ペンテニルオキシカルボニル, 2-ヘキセ  
ニルオキシカルボニル等), アルキニルオキシカルボニル基, 好ましくは炭素数  
2 から 6 のアルキニルオキシ-カルボニル基 (例、プロバルギルオキシカルボ  
ニル, 2-ブチニルオキシカルボニル, 3-ブチニルオキシカルボニル, 3-  
ペンチニルオキシカルボニル, 3-ヘキシニルオキシカルボニル等), シクロ  
15 アルキルオキシカルボニル基, 好ましくは炭素数 3 から 6 のシクロアルキルオ  
キシ-カルボニル基 (例、シクロプロピルオキシカルボニル, シクロブチルオ  
キシカルボニル, シクロペンチルオキシカルボニル, シクロヘキシルオキシカ  
ルボニル等), アリールオキシカルボニル基, 好ましくは炭素数 6 から 14 の  
アリールオキシ-カルボニル基 (例、フェノキシカルボニル基), アラルキル  
20 カルボニル基, 好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキル-カルボニル基 (例、  
ベンジルカルボニル, フェネチルカルボニル, フェニルプロピルカルボニルな  
どのフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニル, ベンズヒドリルカルボニル, ナフ  
チルエチルカルボニルなどのナフチル-C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニル等), アラ  
ルキルオキシカルボニル基, 好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキルオキシ  
25 -カルボニル基 (例、ベンジルオキシカルボニル, フェネチルオキシカルボニ  
ル, フェニルプロピルオキシカルボニルなどのフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルオキシ  
カルボニル), 5~6 員複素環カルボニル基または縮合複素環カルボニル基  
(例、2-または3-ピロリルカルボニルなどのピロリルカルボニル, 3-,  
4-または5-ピラゾリルカルボニルなどのピラゾリルカルボニル, 2-, 4-

- ーまたは5-イミダゾリルカルボニルなどのイミダゾリルカルボニル, 1, 2, 3-トリアゾール-4-イルカルボニル, 1, 2, 4-トリアゾール-3-イルカルボニルなどのトリアゾリルカルボニル, 1H-または2H-テトラゾール-5-イルカルボニルなどのテトラゾリルカルボニル, 2-または3-フリルカルボニルなどのフリルカルボニル, 2-または3-チエニルカルボニルなどのチエニルカルボニル, 2-, 4-または5-オキサゾリルカルボニルなどのオキサゾリルカルボニル, 3-, 4-または5-イソキサゾリルカルボニルなどのイソキサゾリルカルボニル, 1, 2, 3-オキサジアゾール-4-または5-イルカルボニル, 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-または5-イルカルボニル, 1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イルカルボニル, 1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イルカルボニルなどのオキサジアゾリルカルボニル, 2-, 4-または5-チアゾリルカルボニルなどのチアゾリルカルボニル, 3-, 4-または5-イソチアゾリルカルボニルなどのイソチアゾリルカルボニル, 1, 2, 3-チアジアゾール-4-または5-イルカルボニル, 1, 2, 4-チアジアゾール-3-または5-イルカルボニル, 1, 2, 5-チアジアゾール-3-イルカルボニル, 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルカルボニルなどのチアジアゾリルカルボニル, 2-または3-ピロリジニルカルボニルなどのピロリジニルカルボニル, 2-, 3-または4-ピリジルカルボニルなどのピリジルカルボニル, 2-, 3-または4-ピリジル-N-オキシドカルボニルなどの窒素原子が酸化されたピリジルカルボニル, 3-または4-ピリダジニルカルボニルなどのピリダジニルカルボニル, 3-, 4-, 5-または6-ピリダジニル-N-オキシドカルボニルなどの窒素原子の一方または両方が酸化されたピリダジニルカルボニル, 2-, 4-または5-ピリミジニルカルボニルなどのピリミジニルカルボニル, 2-, 4-, 5-または6-ピリミジニル-N-オキシドカルボニルなどの窒素原子の一方または両方が酸化されたピリミジニルカルボニル, ピラジニルカルボニル, 2-, 3-または4-ペリジニルカルボニルなどのペリジニルカルボニル, ピペラジニルカルボニル, 3H-インドール-2-または3-イルカルボニルなどのインドリルカルボニル, 2-, 3-または4-ピラニルカルボニルなどのピラニルカルボ

ニル, 2-, 3-または4-チオピラニルカルボニルなどのチオピラニルカルボニル, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-または8-キノリルカルボニルなどのキノリルカルボニル, イソキノリルカルボニル, ピリド〔2, 3-d〕ピリミジニルカルボニル (例、ピリド〔2, 3-d〕ピリミジン-2-イルカルボニル), 1, 5-, 1, 6-, 1, 7-, 1, 8-, 2, 6-または2, 7-ナフチリジニルカルボニルなどのナフチリジニルカルボニル (例、1, 5-ナフチリジン-2-または3-イルカルボニル), チエノ〔2, 3-d〕ピリジニルカルボニル (例、チエノ〔2, 3-d〕ピリジン-3-イルカルボニル), ピラジノキノリルカルボニル (例、ピラジノ〔2, 3-b〕キノリン-2-イルカルボニル), クロメニルカルボニル (例、2H-クロメン-2-または3-イルカルボニル) 等の窒素原子 (オキシド化されていてもよい), 酸素原子, 硫黄原子 (モノまたはジオキシド化されていてもよい) などのヘテロ原子を1ないし4個含む5~6員複素環カルボニル基、または窒素原子 (オキシド化されていてもよい), 酸素原子, 硫黄原子 (モノまたはジオキシド化されていてもよい) などのヘテロ原子を1ないし4個含む5~6員複素環とベンゼン環もしくは窒素原子 (オキシド化されていてもよい), 酸素原子, 硫黄原子 (モノまたはジオキシド化されていてもよい) などのヘテロ原子を1ないし4個含む5~6員複素環とが縮合した縮合複素環カルボニル基), 5~6員複素環アセチル基 (例、2-ピロリルアセチル, 1-イミダゾリルアセチル, 5-イソオキサゾリルアセチル等の窒素原子 (オキシド化されていてもよい), 酸素原子, 硫黄原子 (モノまたはジオキシド化されていてもよい) などのヘテロ原子を1ないし4個含む5~6員複素環アセチル基) 等が用いられる。

該アシル基がアルキルカルボニル基, アルケニルカルボニル基, アルキニルカルボニル基, アルコキシカルボニル基, アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、置換基として1~3個のヒドロキシ, シアノ, スルファモイル, メルカプト, カルボキシ, アルキルチオ基 (例、メチルチオ, エチルチオ, n-プロピルチオ, イソプロピルチオ, イソブチルチオ等のC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基), ハロゲン原子 (例、フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素), アルコキシ基 (例、メトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, tert-ブ



トキシ, n-ヘキシルオキシ等のC<sub>1-6</sub>アルコキシ基), ニトロ基, アルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル, エトキシカルボニル, n-プロポキシカルボニル, イソプロポキシカルボニル, n-ブトキシカルボニル, イソブトキシカルボニル, sec-ブトキシカルボニル, tert-ブトキシカルボニル等のC<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基), アミノ, アルキルアミノ基(例、メチルアミノ, エチルアミノ, n-プロピルアミノ, n-ブチルアミノ, tert-ブチルアミノ, n-ペンチルアミノ, n-ヘキシルアミノ, ジメチルアミノ, ジエチルアミノ, メチルエチルアミノ, ジー(n-プロピル)アミノ, ジー(n-ブチル)アミノ等のモノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基), アルコキシイミノ基(例、メトキシイミノ, エトキシイミノ, n-プロポキシイミノ, tert-ブトキシイミノ, n-ヘキシルオキシイミノ等のC<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基), ヒドロキシイミノ基などを有していてもよい。

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5~6員複素環アセチル基の場合、ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいアルキル基(例、メチル, エチル, n-プロピル, イソプロピル, n-ブチル, イソブチル, sec-ブチル, tert-ブチル, n-ペンチル, sec-ペンチル, イソペンチル, ネオペンチル, n-ヘキシル, イソヘキシル等のC<sub>1-6</sub>アルキル), シクロアルキル基(例、シクロプロピル, シクロブチル, シクロペンチル, シクロヘキシル等のC<sub>3-6</sub>シクロアルキル), アルケニル基(例、アリル, イソプロペニル, イソブテニル, 1-メチルアリル, 2-ペンテニル, 2-ヘキセニルなどのC<sub>2-6</sub>アルケニル), シクロアルケニル基(例、シクロプロペニル, シクロブテニル, シクロペンテニル, シクロヘキセニルなどのC<sub>3-6</sub>シクロアルケニル), アルキニル基(例、プロパルギル, 2-ブチニル, 3-ブチニル, 3-ペンチニル, 3-ヘキシニル等のC<sub>2-6</sub>アルキニル), ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいアルコキシ基(例、メトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, tert-ブトキシ, n-ヘキシルオキシ等のC<sub>1-6</sub>ア

ルコキシ), アシル基 [例、ホルミル、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル (例、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル等)、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル (例、アリルカルボニル、イソプロペニルカルボニル、イソブテニルカルボニル、1-メチルアリルカルボニル、2-ペンテニルカルボニル、2-ヘキセニルカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル (例、プロパルギルカルボニル、2-ブチニルカルボニル、3-ブチニルカルボニル、3-ペンチニルカルボニル、3-ヘキシニルカルボニル等)、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル (例、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等)、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル (例、ベンゾイル、ナフタレンカルボニル等)、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル (例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル (例、アリルオキシカルボニル、イソプロペニルオキシカルボニル、イソブテニルオキシカルボニル、1-メチルアリルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル、2-ヘキセニルオキシカルボニル等)、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル (例、プロパルギルオキシカルボニル、2-ブチニルオキシカルボニル、3-ブチニルオキシカルボニル、3-ペンチニルオキシカルボニル、3-ヘキシニルオキシカルボニル等)、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル (例、シクロプロピルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニル、シクロヘキシルオキシカルボニル等)、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル (例、フェノキシカルボニル等)、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル (例、ベンジルカルボニル、フェネチルカルボニル、フェニルプロピルカルボニルなどのフェニル- $C_{1-4}$ アルキルカルボニル等)、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル (例、ベンジルオキシカルボニル等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキルオキシカルボニルなど) 等], ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子 (例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、アルキルチオ基 (例、メチル

チオ, エチルチオ, n-プロピルチオ, イソブチルチオ等のC<sub>1-6</sub>アルキルチオ等)などの置換基を1~5個(好ましくは1~3個)有していてもよい。

式-T-Q<sup>0</sup>で表される基は、具体的には、例えばアルキルオキシ基, シクロアルキルオキシ基, アルケニルオキシ基, シクロアルケニルオキシ基, アルキニルオキシ基, アリールオキシ基, アラルキルオキシ基, アリールアルケニルオキシ基, アリールアルキニルオキシ基, 複素環オキシ基, アシルオキシ基, アルキルチオ基, シクロアルキルチオ基, アルケニルチオ基, シクロアルケニルチオ基, アルキニルチオ基, アリールチオ基, アラルキルチオ基, アリールアルケニルチオ基, アリールアルキニルチオ基, 複素環チオ基, アシルチオ基, アルキルジチオ基, アリールジチオ基, アラルキルジチオ基, アルキルスルフィニル基, アルケニルスルフィニル基, アリールスルフィニル基, アラルキルスルフィニル基, 複素環スルフィニル基, アルキルスルホニル基, アルケニルスルホニル基, アリールスルホニル基, アラルキルスルホニル基, 複素環スルホニル基等を示す。

該アルキルオキシ基としては、好ましくは炭素数1から6の直鎖または分枝状のアルキルオキシ基が挙げられ、例えばメトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, イソプロポキシ, n-ブトキシ, イソブトキシ, sec-ブトキシ, tert-ブトキシ, n-ペンチルオキシ, sec-ペンチルオキシ, イソペンチルオキシ, ネオペンチルオキシ, n-ヘキシルオキシ, イソヘキシルオキシ等が用いられる。

該シクロアルキルオキシ基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルキルオキシ基が挙げられ、例えばシクロプロピルオキシ, シクロブチルオキシ, シクロペンチルオキシ, シクロヘキシルオキシ等が用いられる。

該アルケニルオキシ基としては、好ましくは炭素数2から6の直鎖または分枝状のアルケニルオキシ基が挙げられ、例えばアリルオキシ, イソプロペニルオキシ, 1-ブテニルオキシ, 2-ペンテニルオキシ, 2-ヘキセニルオキシ等が用いられる。

該シクロアルケニルオキシ基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルケニルオキシ基が挙げられ、例えばシクロプロペニルオキシ, シクロブテニルオキシ, シクロペンテニルオキシ, シクロヘキセニルオキシなどが用いら

れる。

該アルキニルオキシ基としては、好ましくは炭素数2から6のアルキニルオキシ基が挙げられ、例えばプロパルギルオキシ等が用いられる。

5 該アリールオキシ基としては、好ましくは炭素数6から14のアリールオキシ基が挙げられ、例えばフェノキシ、ナフチルオキシ等が用いられる。

該アラルキルオキシ基としては、好ましくは炭素数7から19のアラルキルオキシ基が挙げられ、例えばベンジルオキシ、フェネチルオキシ、フェニルプロピルオキシ等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキルオキシ基が用いられる。

10 該アリールアルケニルオキシ基としては、好ましくは炭素数8から20のアリールアルケニルオキシ基が挙げられ、例えばスチリルオキシなどの $C_{6-14}$ アリール- $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基が用いられる。

該アリールアルキニルオキシ基としては、好ましくは炭素数8から20のアリールアルキニルオキシ基が挙げられ、例えばフェニルエチニルオキシなどの $C_{6-14}$ アリール- $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基が用いられる。

15 これらの基はいずれも1～5個（好ましくは1～3個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。

該複素環オキシ基としては、式  $T' - O -$  ( $T'$  は上記した置換基群 ( $A'$ ) に包含される置換されていてもよい複素環基と同意義を示す) で表される基が挙げられ、具体的にはピロリルオキシ（例、2-または3-ピロリルオキシ）、ピラゾリルオキシ（例、3-、4-または5-ピラゾリルオキシ）、イミダゾリルオキシ（例、2-、4-または5-イミダゾリルオキシ）、トリアゾリルオキシ（例、1, 2, 3-トリアゾール-4-イルオキシ, 1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ）、テトラゾリルオキシ（例、1H-または2H-テトラゾール-5-イルオキシ）、フリルオキシ（例、2-または3-フリルオキシ）、チエニルオキシ（例、2-または3-チエニルオキシ）、  
20 硫黄原子が酸化されたチエニルオキシ（例、2-または3-チエニル-1, 1-ジオキシド-オキシ）、オキサゾリルオキシ（例、2-、4-または5-オキサゾリルオキシ）等が用いられる。

25 該アシルオキシ基としては、式  $T'' - O -$  ( $T''$  は上記した置換基群

(A')に包含される置換されていてもよいアシル基と同意義を示す)で表される基が挙げられ、具体的にはアセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、ヘキサノイルオキシなどのC<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルオキシ、フェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニルオキシなどのC<sub>7-19</sub>アラルキルカルボニルオキシ(例、ベンジルカルボニルオキシ、フェネチルカルボニルオキシ)、ベンゾイルオキシ、ナフトイルオキシなどのC<sub>6-14</sub>アリールカルボニルオキシ、チエニルカルボニルオキシ、ベンゾチエニルカルボニルオキシなどの複素環-カルボニルオキシ等が用いられる。

該アルキルチオ基としては、好ましくは炭素数1から6の直鎖または分枝状のアルキルチオ基が挙げられ、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、n-ペンチルチオ、sec-ペンチルチオ、イソペンチルチオ、ネオペンチルチオ、n-ヘキシルチオ、イソヘキシルチオ等が用いられる。

該シクロアルキルチオ基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルキルチオ基が挙げられ、例えばシクロプロピルチオ、シクロブチルチオ、シクロペンチルチオ、シクロヘキシルチオ等が用いられる。

該アルケニルチオ基としては、好ましくは炭素数2から6の直鎖または分枝状のアルケニルチオ基が挙げられ、例えばアリルチオ、イソプロペニルチオ、1-ブテニルチオ、2-ペンテニルチオ、2-ヘキセニルチオ等が用いられる。

該シクロアルケニルチオ基としては、好ましくは炭素数3から6のシクロアルケニルチオ基が挙げられ、例えばシクロプロペニルチオ、シクロブテニルチオ、シクロペンテニルチオ、シクロヘキセニルチオなどが用いられる。

該アルキニルチオ基としては、好ましくは炭素数2から6のアルキニルチオ基が挙げられ、例えばプロバルギルチオ等が用いられる。

該アリールチオ基としては、好ましくは炭素数6から14のアリールチオ基が挙げられ、例えばフェニルチオ、ナフチルチオ等が用いられる。

該アラルキルチオ基としては、好ましくは炭素数7から19のアラルキルチオ基が挙げられ、例えばベンジルチオ、フェネチルチオ、フェニルプロピルチオ等のフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルチオ基等が用いられる。

該アリールアルケニルチオ基としては、好ましくは炭素数 8 から 20 のアリールアルケニルチオ基が挙げられ、例えばスチリルチオなどの  $C_{6-14}$  アリール- $C_{2-6}$  アルケニルチオ基が用いられる。

5 該アリールアルキニルチオ基としては、好ましくは炭素数 8 から 20 のアリールアルキニルチオ基が挙げられ、例えばフェニルエチニルチオなどの  $C_{6-14}$  アリール- $C_{2-6}$  アルキニルチオ基が用いられる。

これらの基（アルキルチオ基、シクロアルキルチオ基、アルケニルチオ基、シクロアルケニルチオ基、アルキニルチオ基、アリールチオ基、アラルキルチオ基、アリールアルケニルチオ基、アリールアルキニルチオ基）はいずれも 1  
10 ～5 個（好ましくは 1 ～3 個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。

該複素環チオ基としては、式  $T' - S -$ （ $T'$  は上記と同意義を示す）で表される基が挙げられ、具体的にはピロリルチオ（例、2-または 3-ピロリルチオ）、ピラゾリルチオ（例、3-、4-または 5-ピラゾリルチオ）、イ  
15 ミダゾリルチオ（例、2-、4-または 5-イミダゾリルチオ）、トリアゾリルチオ（例、1, 2, 3-トリアゾール-4-イルチオ、1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオ）、テトラゾリルチオ（例、1H-または 2H-テトラゾール-5-イルチオ）、フリルチオ（例、2-または 3-フリルチオ）、チエニルチオ（例、2-または 3-チエニルチオ）、チエニル基の硫黄原子が酸  
20 化されたチエニルチオ（例、2-または 3-チエニル-1, 1-ジオキシドチオ）、オキサゾリルチオ（例、2-、4-または 5-オキサゾリルチオ）等が用いられる。

該アシルチオ基としては、式  $T'' - S -$ （ $T''$  は上記と同意義を示す）で表される基が挙げられ、具体的にはアセチルチオ、プロピオニルチオ、ブチリ  
25 ルチオ、ペンタノイルチオ、ヘキサノイルチオなどの  $C_{1-6}$  アルキル-カルボニルチオ、ベンジルカルボニルチオ、フェネチルカルボニルチオなどのフェニル- $C_{1-4}$  アルキルカルボニルチオ、ベンゾイルチオ、ナフトイルチオなどの  $C_{6-14}$  アリールカルボニルチオ、チエニルカルボニルチオ、ベンゾチエニルカルボニルチオなどの複素環-カルボニルチオ等が用いられる。

該アルキルジチオ基としては、好ましくは炭素数 1 から 6 の直鎖または分枝状のアルキルジチオ基が挙げられ、例えばメチルジチオ、エチルジチオ、 $n$ -プロピルジチオ等が用いられる。

5 該アリールジチオ基としては、好ましくは炭素数 6 から 14 のアリールジチオ基が挙げられ、例えばフェニルジチオ、ナフチルジチオ等が用いられる。

該アラルキルジチオ基としては、好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキルジチオ基が挙げられ、例えばベンジルジチオ、フェネチルジチオ等のフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルジチオ基等が用いられる。

10 該アルキルスルフィニル基としては、好ましくは炭素数 1 から 6 の直鎖または分枝状のアルキルスルフィニル基が挙げられ、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 $n$ -プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、 $n$ -ヘキシルスルフィニル等が用いられる。

15 該アルケニルスルフィニル基としては、好ましくは炭素数 2 から 6 の直鎖または分枝状のアルケニルスルフィニル基が挙げられ、例えばアリルスルフィニル等が用いられる。

該アリールスルフィニル基としては、好ましくは炭素数 6 から 14 のアリールスルフィニル基が挙げられ、例えばフェニルスルフィニル等が用いられる。

20 該アラルキルスルフィニル基としては、好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキルスルフィニル基が挙げられ、例えばベンジルスルフィニル等のフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルスルフィニルが用いられる。

これらの基（アルキルジチオ基、アリールジチオ基、アラルキルジチオ基、アルキルスルフィニル基、アルケニルスルフィニル基、アリールスルフィニル基、アラルキルスルフィニル基）はいずれも 1～5 個（好ましくは 1～3 個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。

25 該複素環スルフィニル基としては、式  $T'-SO-$ （ $T'$  は上記と同意義を示す）で表される基が挙げられ、具体的にはピロリルスルフィニル（例、2-または 3-ピロリルスルフィニル）、ピラゾリルスルフィニル（例、3-、4-または 5-ピラゾリルスルフィニル）等が用いられる。

該アルキルスルホニル基としては、好ましくは炭素数 1 から 6 の直鎖または

分枝状のアルキルスルホニル基が挙げられ、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、*n*-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル等が用いられる。

5 該アルケニルスルホニル基としては、好ましくは炭素数 2 から 6 の直鎖または分枝状のアルケニルスルホニル基が挙げられ、例えばアリルスルホニル等が用いられる。

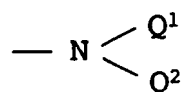
該アリールスルホニル基としては、好ましくは炭素数 6 から 14 のアリールスルホニル基が挙げられ、例えばフェニルスルホニル、ナフチルスルホニル等が用いられる。

10 該アラルキルスルホニル基としては、好ましくは炭素数 7 から 19 のアラルキルスルホニル基が挙げられ、例えばベンジルスルホニル、フェネチルスルホニル、フェニルプロピルスルホニル等のフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルスルホニル基が用いられる。

これらの基（アルキルスルホニル基、アルケニルスルホニル基、アリールスルホニル基、アラルキルスルホニル基）はいずれも 1 ～ 5 個（好ましくは 1 ～ 3 個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。

20 該複素環スルホニル基としては、式  $T'-SO_2-$ （ $T'$  は上記と同意義を示す）で表される基が挙げられ、具体的にはピロリルスルホニル（例、2-または 3-ピロリルスルホニル）、ピラゾリルスルホニル（例、3-、4-または 5-ピラゾリルスルホニル）等が用いられる。

式



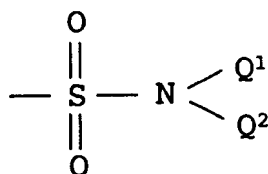
25 で表される基としては、具体的には、①アルキルアミノ基、好ましくはモノ又はジ（炭素数 1 から 6 のアルキル）アミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-プロピルアミノ、*n*-ブチルアミノ、*tert*-ブチルアミノ、*n*-ペンチルアミノ、*n*-ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジ-（*n*-プロピル）アミノ、ジ-（*n*-ブチル）アミノ等）、



- ②シクロアルキルアミノ基、好ましくはモノ又はジ（炭素数3から6のシクロアルキル）アミノ基（例えば、シクロプロピルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、ジシクロヘキシルアミノ等）、③アリールアミノ基、好ましくは炭素数6から14のアリールアミノ基（例えば、アニリノ等）、  
5  $N-C_{1-6}$ アルキル- $N-C_{6-14}$ アリールアミノ（例、 $N$ -メチルアニリノ等）、  
④アラルキルアミノ基、好ましくは炭素数7から19のアラルキルアミノ基（例えば、ベンジルアミノ、1-フェニルエチルアミノなどのフェニル- $C_{1-4}$ アルキルアミノ、ベンズヒドリルアミノ、トリチルアミノ等）、⑤アシルアミノ基、すなわち、式 $T''''N-$ （ $T''''$ は水素原子、上記した炭化水素基または上記アシル基（置換基群（A'）に包含される置換されていてもよいアシル基におけるアシル基）を、 $T''''$ は $T''''$ で示されるアシル基と同意義を示し、 $T''''$ および $T''''$ は窒素原子と共に環を形成してもよい）で表される基で、具体的にはホルムアミド、アセトアミド、プロピオンアミド、ブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、2-オキソピロリジノ、スクシンイミド、  
15 ベンジルカルボニルアミノ、フェネチルカルボニルアミノ、ベンゾイルアミノ（ベンズアミド）、ナフトイルアミノ、フタルイミド、チエニルカルボニルアミノ、ベンゾチエニルカルボニルアミノ等の $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{6-14}$ アリールカルボニルアミノ、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニルアミノ、複素環カルボニルアミノ（該複素環カルボニルアミノにおける複素環基は上記置換基群（A'）に包含される置換されていてもよい複素環基における複素環基を示す。）等が用いられる。①～④の各基はいずれも1～5個（好ましくは1～3個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。また⑤のうち基 $T''''$ が炭化水素基を示す場合、この基は1～5個（好ましくは1～3個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよく、基 $T''''$ または $T''''$ が $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基を示す場合、これらの基は1～5個（好ましくは1～3個）のハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。ここで $Q^1$ および $Q^2$ は、  
25 隣接する窒素原子とともに環を形成してもよく、好ましくは3ないし7員環（例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、1-ピペ

ラジニル、アジリジノ、アゼチジノ等）を形成してもよい。

式



- で表される基としては、具体的には、①モノまたはジアルキルスルファモイル
- 5 基、好ましくはモノまたはジ（炭素数 1 から 6 のアルキル）スルファモイル基  
（例えばメチルスルファモイル、エチルスルファモイル、*n*-プロピルスル  
ファモイル、*n*-ヘキシルスルファモイル、ジメチルスルファモイル、ジエチ  
ルスルファモイル、メチルエチルスルファモイル、ジー（*n*-ブチル）スル  
ファモイル等）、②シクロアルキルスルファモイル基、好ましくは炭素数 3 から
- 10 から 6 のシクロアルキルスルファモイル基（例えば、シクロプロピルスルファモ  
イル、シクロヘキシルスルファモイル等）、③アリールスルファモイル基、好  
ましくは炭素数 6 から 14 のアリールスルファモイル基（例えば、フェニルス  
ルファモイル等）、④アラルキルスルファモイル基、好ましくは炭素数 7 から
- 15 19 のアラルキルスルファモイル基（例えば、ベンジルスルファモイル、フェ  
ニルエチルスルファモイルなどのフェニル-C<sub>1-4</sub>アルキルスルファモイル、  
ベンズヒドリルスルファモイル、トリチルスルファモイル等）、⑤アシルスル  
ファモイル基、すなわち、式 T<sup>'''</sup>T<sup>'''</sup>NSO<sub>2</sub>-（各記号は前記と同意義を示  
す）で表される基（例えば、アセチルスルファモイルなどのC<sub>1-6</sub>アルキルカ  
ルボニルスルファモイル、ベンジルカルボニルスルファモイルなどのフェニル
- 20 -C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニルスルファモイル、チエニルカルボニルスルファモ  
イルなどの複素環-カルボニルスルファモイル等）が用いられる。①～④の各  
基はいずれも 1～5 個（好ましくは 1～3 個）のハロゲン原子（例、フッ素、  
塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよい。また⑤のうち基 T<sup>'''</sup>が炭化水  
素基を示す場合、この基は 1～5 個（好ましくは 1～3 個）のハロゲン原子
- 25 （例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で置換されていてもよく、基 T<sup>'''</sup>または  
T<sup>'''</sup>がC<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基を示す場合、これらの基は 1～5 個（好ま

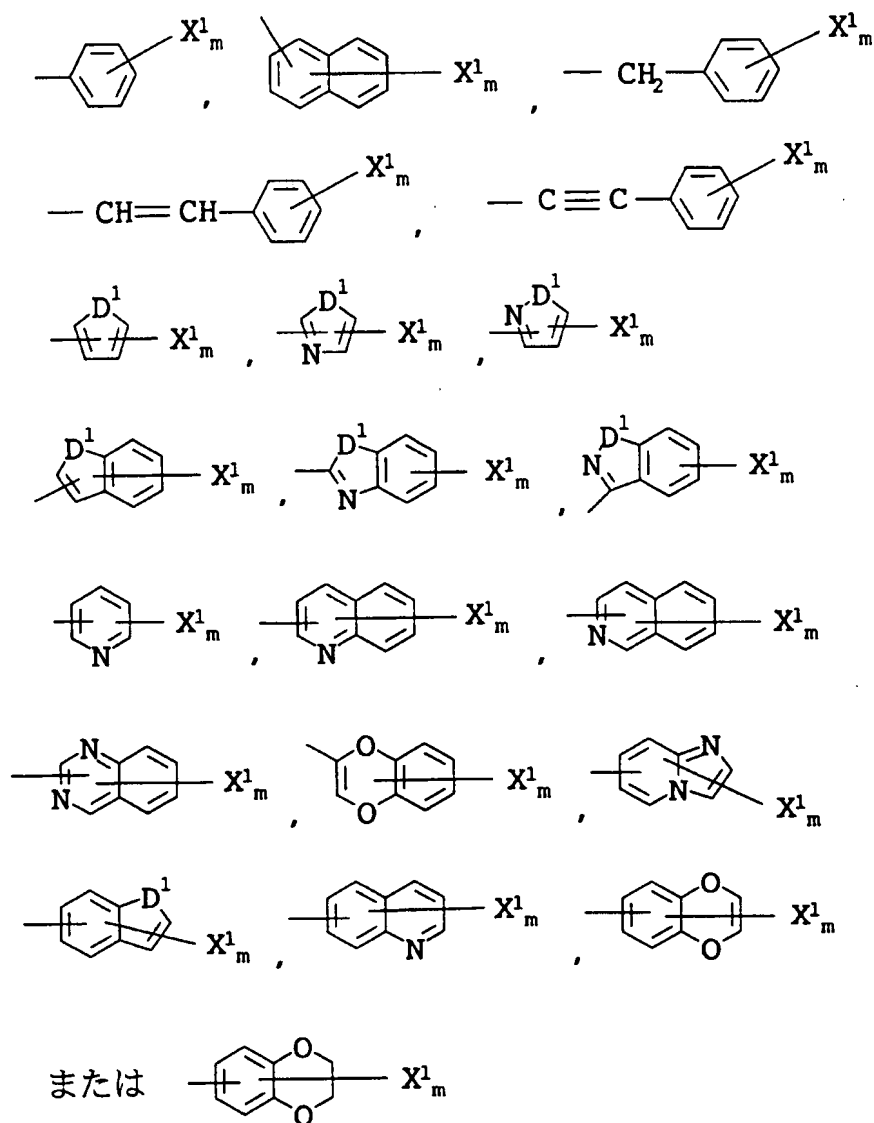
しくは1～3個)のハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で置換されていてもよい。ここで $Q^1$ および $Q^2$ は、隣接する窒素原子とともに環を形成してもよく、例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、1-ピペラジニル、アジリジノ、アゼチジノ等を形成してもよい。

- 5 式  $Q^2-SO_2-O-$ で表される基としては、具体的には、①アルキルスルホニルオキシ基、好ましくは炭素数1から6のアルキルスルホニルオキシ基(例えば、メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ等)、②アリー  
ルスルホニルオキシ基、好ましくは炭素数6から14のアリールスルホニルオ  
キシ基(例えば、ベンゼンスルホニルオキシ等)、③アラルキルスルホニルオ  
10 キシ基、好ましくは炭素数7から19のアラルキルスルホニルオキシ基(例え  
ば、ベンジルスルホニルオキシ、フェネチルスルホニルオキシなどのフェニル  
- $C_{1-4}$ アルキルスルホニルオキシ等)、④アシルスルホニルオキシ基(例え  
ば、アセチルスルホニルオキシ、ブチリルスルホニルオキシなどの $C_{1-6}$ アル  
キルカルボニルスルホニルオキシ等)が用いられる。①～③の各基はいずれも  
15 1～5個(好ましくは1～3個)のハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、  
ヨウ素)で置換されていてもよい。また④のうち $C_{1-6}$ アルキルカルボニルス  
ルホニルオキシ基は1～5個(好ましくは1～3個)のハロゲン原子(例、  
フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で置換されていてもよい。

- 20  $R^1$ で示される置換されていてもよい複素環基としては、上記置換基群  
(A')に包含される置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

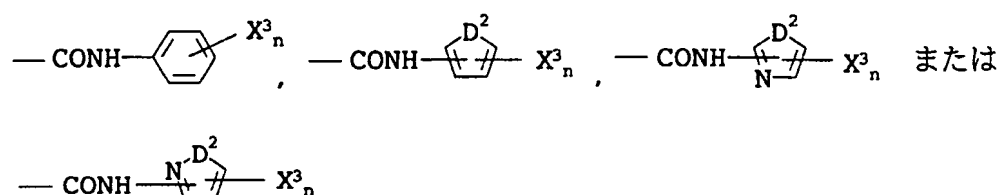
- $R^1$ で示されるカルバモイル基( $-CONR^5R^6$ )における $R^5$ または $R^6$ と  
しては、水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい  
複素環基が挙げられる。該置換されていてもよい炭化水素基および置換されて  
いてもよい複素環基は前記 $R^1$ で示される置換されていてもよい炭化水素基お  
25 び置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

$R^1$ は上記した中でも式



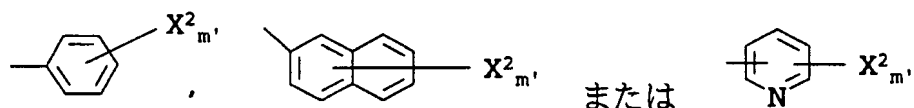
- [式中、 $\text{X}^1$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルチオ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニス

- ルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、アミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、ベンジル基、ベンジロキシ基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、  
 5 または $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基を示すか、隣接する2つの $X^1$ が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよく、 $m$ は0~3の整数を示し、 $D^1$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d1}$ (式中、 $R^{d1}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。)で表される基を示す。]で表される基、または式



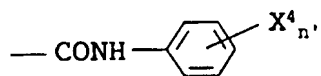
- 10 [式中、 $X^3$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、フェノキシ基、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、または  
 15 ニトロ基を、 $n$ は0~3の整数を、 $D^2$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d2}$ (式中、 $R^{d2}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。)で表される基を示す。]で表される基が好ましい。

- 20 特に、 $R^1$ は式



[式中、 $X^2$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または $C_{1-6}$ アルコキシ基を、 $m'$ は0~3の整

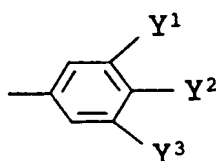
数を示す。]で表される基、または式



[式中、 $\text{X}^4$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基または $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基を、 $n'$ は0～3の整数を示す。]で表される基が好ましく、

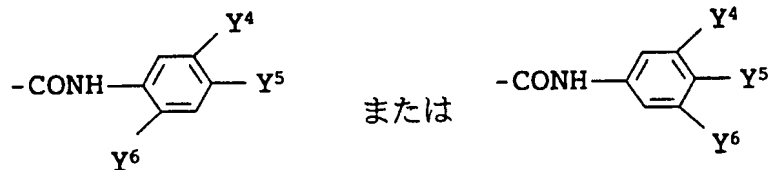
5

式



[式中、 $\text{Y}^1$ はハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基または $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基を、 $\text{Y}^2$ および $\text{Y}^3$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基または $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基を示す。]で表される基、または式

10



[式中、 $\text{Y}^4$ はハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基または $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基を、 $\text{Y}^5$ および $\text{Y}^6$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を示す。]で表される基がより好ましい。

15

$\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ で示される置換されていてもよい炭化水素基としては、前記 $\text{R}^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。

中でも、置換されていてもよい炭素数1から6の直鎖もしくは分枝状アルキル基（例、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、*sec*-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、*n*-ヘキシル、イソヘキシル等の $\text{C}_{1-6}$ アルキル基等）が好ましい。

20

該アルキル基の置換基としては、ハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）が好ましい。該置換基の数は1～4個（好ましくは1～3個）である。

$R^2$ 及び $R^3$ が隣接する炭素原子と一緒に形成してもよい置換されていてもよい3ないし8員の環状炭化水素基としては、例えばシクロプロパン-1,  
5 1-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロヘキサン-1, 1-ジイル、シクロヘプタン-1, 1-ジイル及びシクロオクタン-1, 1-ジイルなどの $C_{3-8}$ シクロアルカンジイル基等が用いられる。 $R^2$ 及び $R^3$ が隣接する炭素原子と一緒に形成される3ないし8員の環状炭化水素基の置換基としては上記 $R^1$ で示される複素環基の置換基と同様のものが挙げられ、好ましくはハロゲン原子が用いられる。置換基の数は1～3個である。

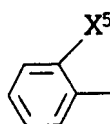
$R^2$ および $R^3$ はそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基が好ましい。特に、 $R^2$ および $R^3$ はそれぞれメチルもしくはエチルなどの $C_{1-6}$ アルキル基が好ましい。

15  $R^4$ で示される置換されていてもよい炭化水素基及び置換されていてもよい複素環基としては上記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基及び置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

$R^7$ で示される置換されていてもよい炭化水素基及び置換されていてもよい複素環基としては上記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基及び置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

20  $R^4$ としては(i)それぞれハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基およびハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよい(i)フェニル基、(ii)ナフチル基（例、1-ナフチル基、2-ナフチル基）または(iii)チエニル基（例、2-チエニル基、3-チエニル基）、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(3)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、(4)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、または(5)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいフェノキシ基が好ましい。

R<sup>4</sup>としては特に式



[式中、X<sup>5</sup>は水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基またはハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を示す。]で表される基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基またはハロゲンで1～3個置換されていてもよいフェノキシ基が好ましい。

R<sup>8</sup>における置換されていてもよい炭化水素基としては前記R<sup>1</sup>における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。

R<sup>8</sup>としては水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基（例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等）が好ましい。

R<sup>9</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基としては前記R<sup>1</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

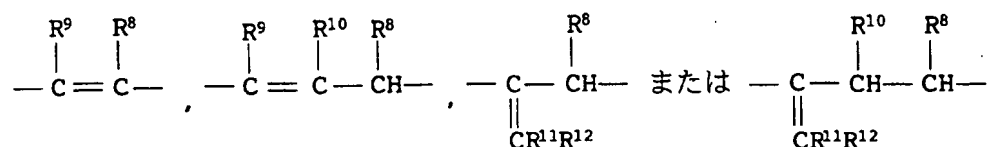
R<sup>9</sup>における置換されていてもよいアシル基としては前記置換基群（A'）における置換されていてもよいアシル基と同様のものが挙げられる。

R<sup>15</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基としては前記R<sup>1</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。R<sup>9</sup>としては(i)水素原子、(2) (i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ基、(iii)C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(iv)C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、(v)C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、(vi)C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、(vii)C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基または(viii)式=N-OR<sup>14</sup> [式中、R<sup>14</sup>は前記と同意義を示す。]で表される基で1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、(3)C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、(4)C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(5)C<sub>1-6</sub>アルコキシで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(6)シアノ基、(7)ホルミル基または(8)ヒドロキシ基が好ましい。特に水素原子、ま



たはヒドロキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基もしくは $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基が好ましい。

—A—は式



- 5 (式中、各記号は前記と同意義を示す。) で表される基を示すが、特に



(式中、各記号は前記と同意義を示す。) で表される基が好ましい。

- 10  $R^{10}$ における置換されていてもよい炭化水素基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。 $R^{10}$ としては水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル等)が好ましい。

- 15  $R^{11}$ におけるハロゲン原子としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。 $R^{11}$ における置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。

- 20  $R^{16}$ における置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。 $R^{16}$ における置換されていてもよいアシル基としては前記置換基群(A')における置換されていてもよいアシル基と同様のものが挙げられる。

$R^{11}$ としてはとりわけ水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、

$C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基が好ましい。

$R^{12}$ におけるハロゲン原子としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。 $R^{12}$ における置換されていてもよい炭化水素基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。 $R^{12}$ としてはとりわけ水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基が好ましい。

Zにおけるハロゲン原子としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。Zにおける置換されていてもよい炭化水素基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。Zにおける置換されていてもよいアシル基としては前記置換基群(A')における置換されていてもよいアシル基と同様のものが挙げられる。 $R^{5a}$ 及び $R^{6a}$ における置換されていてもよい炭化水素基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。Zとしてはハロゲン原子、シアノ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、式

15  $-CO_2R^{17}$

[式中、 $R^{17}$ は(i)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)または(ii)ハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、(ii)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)または(iii)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ等)で1～3個置換されていてもよい $C_{7-19}$ アラルキル基(例、ベンジル、フェネチル等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキル)を示す。]で表される基、

25 式

$-COR^{17x}$

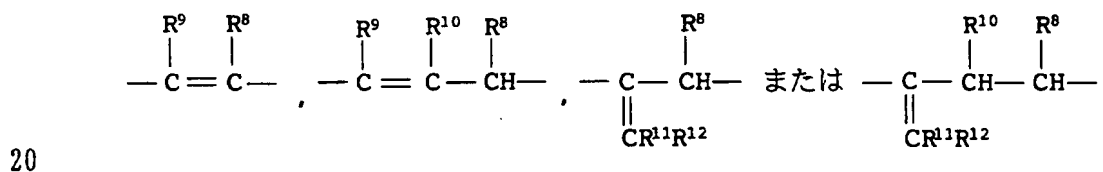
[式中、 $R^{17x}$ は水素原子またはハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)を示す。]で表される基、または式



[式中、 $\text{R}^{5b}$ 及び $\text{R}^{6b}$ は各々水素原子またはハロゲン（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基（例、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル等）を示す。]で表される基が好ましい。なかでもメトキシカルボニル、エトキシカルボニルなどの $\text{C}_{1-6}$ アルコキシカルボニル、アセチルなどの $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニル、*N*-(*tert*-ブチル)カルバモイルなどの $\text{N}$ -( $\text{C}_{1-6}$ アルキル)カルバモイル等が好ましい。

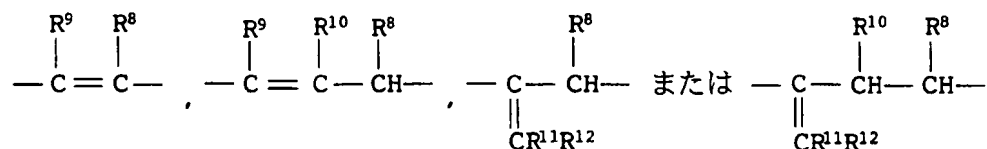
一般式（I）で表される化合物のうち好ましい態様は以下の①および②で示される。

① $\text{R}^1$ は（1）それぞれハロゲン、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基もしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基で1～3個置換されていてもよい（i）フェニル基、（ii）ナフチル基または（iii）ピリジル基または（2）ハロゲン、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基もしくは $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基で1～3個置換されていてもよいフェニル基で置換されたカルバモイル基を、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ はそれぞれ $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を、 $\text{R}^4$ は（1）ハロゲンもしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキル基で1～3個置換されていてもよいフェニル基または（2） $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基を、 $-\text{A}-$ は式



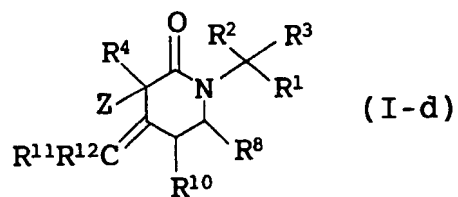
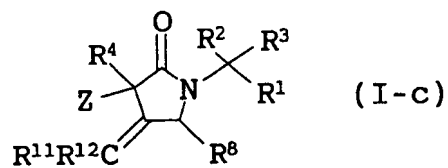
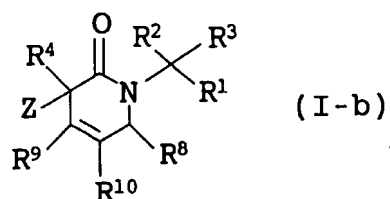
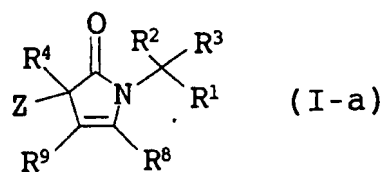
（式中、 $\text{R}^8$ は水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を、 $\text{R}^9$ は（i）水素原子、（ii）ハロゲン、ヒドロキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、ヒドロキシイミノ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシイミノ基もしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシイミノ基で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、（iii） $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、（iv） $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、（v）

- 5 )  $C_{1-6}$ アルコキシ基で1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(v  
i)ホルミル基、(vii)シアノ基または(viii)ヒドロキシ基を、 $R^{10}$ は水素  
原子または $C_{1-6}$ アルキル基を、 $R^{11}$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ ア  
ルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基または $C_{1-}$   
6アルキルスルホニル基を、 $R^{12}$ は水素原子を示す。)で表される基を、Zは(1)  
ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、  
(2)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{7-9}$ アラルキルオキシカル  
ボニル基、(3) $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基または(4)モノもしくはジ  
( $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイル基を示す化合物またはその塩。
- 10 ② $R^1$ は(i)ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキル  
チオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基もしくは $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基で  
1~3個置換されていてもよいフェニル基、(2)ナフチル基、(3)ハロゲンで1~  
3個置換されていてもよいピリジル基、(4)キノリル基、(5)イソキノリル基、(6  
) $C_{1-4}$ アルキルで1~3個置換されていてもよいキナゾリニル基、(7)ハロゲン  
15 で1~3個置換されていてもよいイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル基、(8)ハロ  
ゲンで1~3個置換されていてもよい1, 4-ベンゾジオキシニル基、(9)ハロ  
ゲンで1~3個置換されていてもよい2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキ  
シニル基、(10)ベンゾフラニル基または(11)(i)ハロゲン、ハロゲンで1~3個  
置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニ  
20 ル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ ア  
ルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ ア  
ルキルカルボニルアミノ基およびシアノ基から選ばれる1~3個の置換基で置  
換されていてもよいフェニル基または(ii) $C_{1-6}$ アルキルで1~2個置換されて  
いてもよいチアゾリル基で置換されたカルバモイル基を、 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞ  
25 れ $C_{1-6}$ アルキル基を、 $R^4$ は(i)ハロゲンもしくは $C_{1-6}$ アルキル基で1~3個  
置換されていてもよいフェニル基または(2) $C_{1-6}$ アルコキシ基を、-A-は式



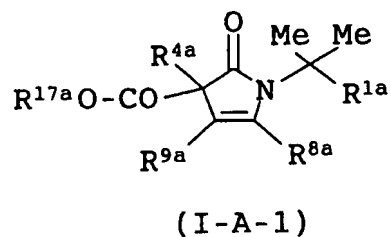
- (式中、 $\text{R}^8$ は水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を、 $\text{R}^9$ は(1)水素原子、(2)ハロゲン、ヒドロキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基、ヒドロキシイミノ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシイミノ基もしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシイミノ基で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、(3) $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、(4) $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、(5) $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、(6)ホルミル基、(7)シアノ基または(8)ヒドロキシ基を、 $\text{R}^{10}$ は水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を、 $\text{R}^{11}$ は水素原子、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基または $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基を、 $\text{R}^{12}$ は水素原子を示す。)
- で表される基を、 $\text{Z}$ は(1)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、(3) $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基または(4)モノもしくはジ( $\text{C}_{1-6}$ アルキル)カルバモイル基を示す化合物またはその塩。

上記一般式(I)で表される化合物は-A-で示される基により下記式(I-a)、(I-b)、(I-c)及び(I-d)に分けて示すことができる。

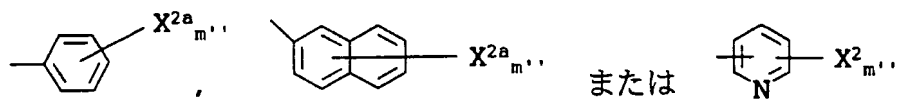


(式中の各記号は前記と同意義を示す。)

上記一般式 (I-a) で表される化合物の中で好ましいものとして一般式

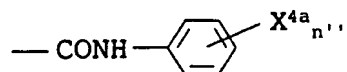


5 [式中、 $R^{1a}$ は式



(式中、 $X^{2a}$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換さ

れていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または $C_{1-6}$ アルコキシ基を、 $m''$ は0～3の整数を示す。)で表される基または式



(式中、 $X^{4a}$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または $C_{2-6}$ アルキニル基を、 $n''$ は0～3の整数を示す。)で表される基を、

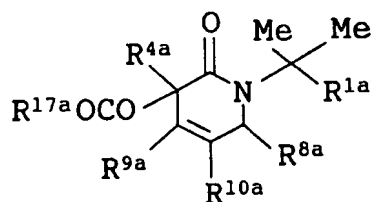
$R^{4a}$ は1～3個の同一もしくは異なる、ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基で置換されていてもよい(i)フェニル基、(ii)ナフチル基(例、1-ナフチル基、2-ナフチル基)もしくは(iii)チエニル基(例、2-チエニル基、3-チエニル基)または式



(式中、 $R^{7a}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルケニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルキニル基、または同一もしくは異なるハロゲン原子で1～3個置換されていてもよいフェニル基を示す。)で表される基を、 $R^{8a}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を、

$R^{9a}$ は水素原子またはヒドロキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基もしくは $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を、 $R^{17a}$ は(i)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(ii)ハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基で1～3個置換されていてもよいベンジル基を示す。)で表される化合物が挙げられる。

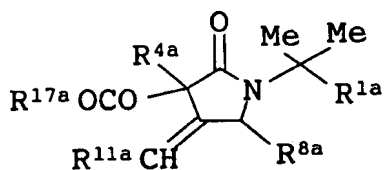
上記一般式(I-b)で表される化合物の中で好ましいものとして一般式



(I-B-1)

[式中、 $R^{10a}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物が挙げられる。

上記一般式 (I-c) で表される化合物の中で好ましいものとして一般式

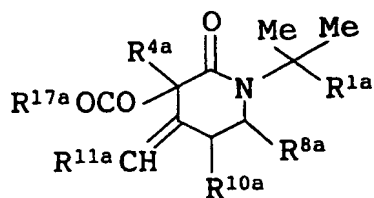


(I-C-1)

5

[式中、 $R^{11a}$ は水素原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基または $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基を、他の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物が挙げられる。

10 上記一般式 (I-d) で表される化合物の中で好ましいものとして一般式



(I-D-1)

[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物が挙げられる。

本発明の化合物 (I) は分子中の置換分中のスルホ基、カルボキシル基等の酸性基が無機塩基、有機塩基等と農芸化学的に許容され得る塩基塩を形成することができ、また分子中の塩基性の窒素原子及び置換分中のアミノ基等の塩基性基が無機酸、有機酸等と農芸化学的に許容され得る酸付加塩を形成することができる。

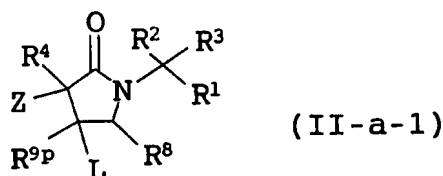
15



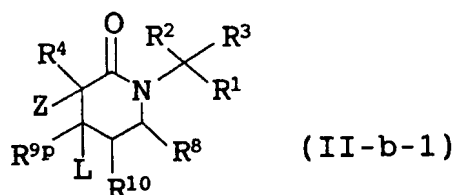
化合物 (I) の無機塩基塩としては例えば、アルカリ金属（例えば、ナトリウム、カリウム等）、アルカリ土類金属（例えば、カルシウム等）、アンモニア等との塩が、また化合物 (I) の有機塩基塩としては例えば、ジメチルアミン、トリエチルアミン、ピペラジン、ピロリジン、ピペリジン、2-フェニルエチルアミン、ベンジルアミン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、ピリジン、コリジン等との塩等が用いられる。

化合物 (I) の無機酸付加塩としては例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸等との塩が、化合物 (I) の有機酸付加塩としては例えば、p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、ギ酸、トリフルオロ酢酸等との塩が用いられる。

10 本発明は式



[式中、R<sup>9p</sup>は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を、Lは脱離基を、他の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩、および式



15

[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩にも関する。

R<sup>9p</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基としては前記R<sup>9</sup>における置換されていてもよい炭化水素基および置換されていてもよい複素環基と同様のものが挙げられる。R<sup>9p</sup>としては(i)水素原子、(2)(i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ基、(iii)C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(iv)C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、(v)C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、(vi)C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、(vii)C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルオキシ基または(viii)式=N-OR<sup>14</sup>

20

<sup>4</sup>[式中、R<sup>14</sup>は前記と同意義を示す。]で表される基で1~3個置換されていて

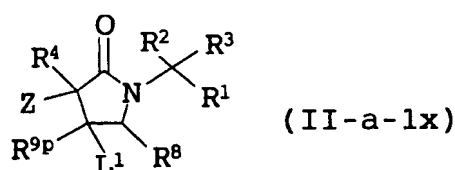
もよい $C_{1-6}$ アルキル基、(3)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基または(4)  $C_{2-6}$ アルケニル基が好ましい。特に(1)水素原子、(2)ハロゲン、ヒドロキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基もしくは $C_{1-6}$ アルキルチオ基で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基または(3)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基が好ましい。

- 5      Lで表される脱離基としてはハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、ヒドロキシ基、 $-OS(O)Cl$ または式 $-OS(O)_2R^{18}$ （式中、 $R^{18}$ は置換されていてもよい炭化水素基を示す。）で表される基等が挙げられる。

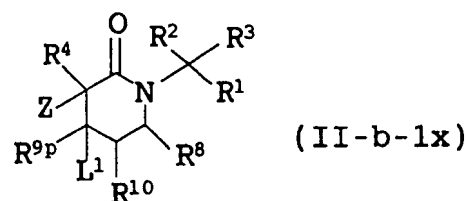
- 10       $R^{18}$ における置換されていてもよい炭化水素基としては前記 $R^1$ における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられ、好ましくはメチル、トリフルオロメチル、4-メチルフェニル等である。

Lとしては特にハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、ヒドロキシ基、 $-OS(O)Cl$ またはトリフルオロメチルスルホニルオキシ基が好ましい。

- 15      式(II-a-1)および(II-b-1)で表される化合物のうち、脱離基Lとしてハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、ヒドロキシ基、 $-OS(O)Cl$ または式 $-OS(O)_2R^{18}$ （式中、 $R^{18}$ は前記と同意義を示す。）で表される基を示す化合物は各々式

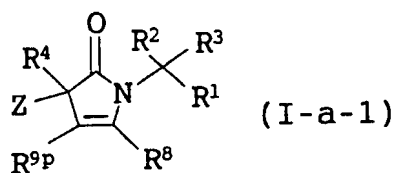


- 20      [式中、 $L^1$ はハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、ヒドロキシ基、 $-OS(O)Cl$ または式 $-OS(O)_2R^{18}$ （式中、 $R^{18}$ は前記と同意義を示す。）で表される基を、他の記号は前記と同意義を示す。]および式



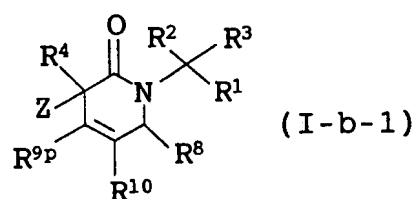
[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される。

化合物 (II-a-1) またはその塩は化合物 (I) またはその塩のうち、式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩、または式 (I-c) で表される化合物もしくはその塩の合成中間体であり、化合物 (II-b-

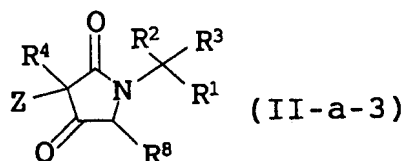
5 1) またはその塩は化合物 (I) またはその塩のうち、式



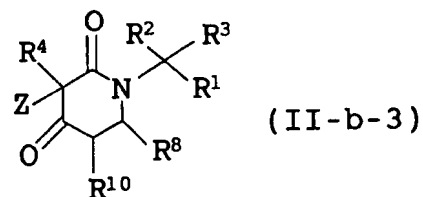
[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩、または式 (I-d) で表される化合物もしくはその塩の合成中間体である。

化合物 (II-a-1)、(II-b-1)、(II-a-1x) および (II-b-1x) の塩としては  
10 上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

本発明は式

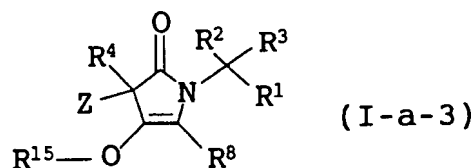


[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩、および式

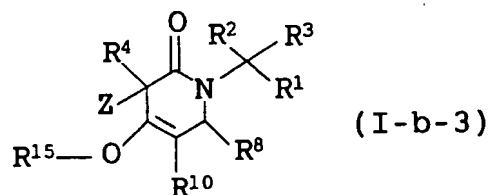


15 [式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩にも関する。

化合物 (II-a-3) またはその塩は化合物 (I) またはその塩のうち、式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩の合成中間体であり、化合物 (II-b-3) またはその塩は化合物 (I) またはその塩のうち、式



5

[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩の合成中間体である。

化合物 (II-a-3) 及び (II-b-3) はともにケト-エノール互変異性のケト互変異性体を示しているが、これらの化合物はそれぞれ化合物 (I-a-3) 及び (I-b-3) で基  $R^{15}$  が水素原子を示す化合物 (I-a-3a) 及び (I-b-3a) で表されるエノール互変異性体として存在することもできる。またそれぞれ該ケト及びエノール互変異性体の混合物として存在することもできる。

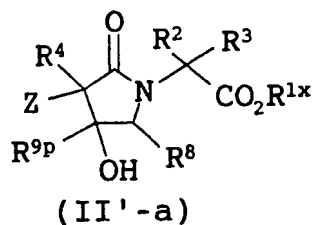
10

化合物 (II-a-3) および (II-b-3) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

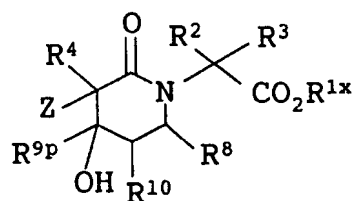
15

本願明細書の以下の部分において上記した本発明の化合物 (II-a-1)、(II-b-1)、(II-a-3) および (II-b-3) を総称して本発明化合物 (II) と呼称することがある。

本発明は式



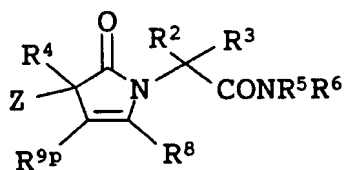
[式中、 $R^{1*}$ は水素原子、ベンジル基またはtert-ブチル基を、他の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩、および式



(II'-b)

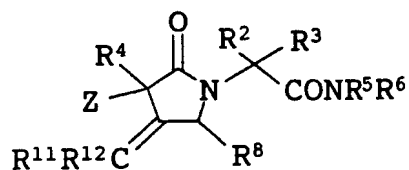
[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩にも関する。

- 5 化合物 (II'-a) またはその塩のうち、基  $R^{1*}$  が水素原子を示す化合物 (II'-a-1) またはその塩は、化合物 (I-a-1) もしくはその塩のうち、基  $R^1$  が式  $CONR^5R^6$  (式中の記号は前記と同意義を示す。) で表される基を示す化合物、即ち式



(I-a-1r)

- 10 [式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩、または化合物 (I-c) もしくはその塩のうち、基  $R^1$  が式  $CONR^5R^6$  (式中の記号は前記と同意義を示す。) で表される基を示す化合物、即ち式

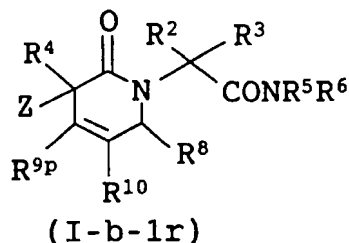


(I-c-r)

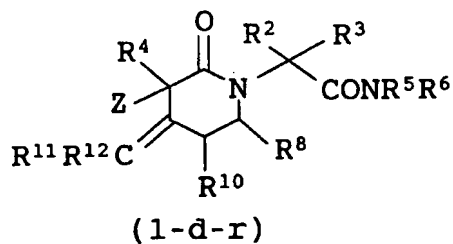
[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩の合成中間体である。

- 15 化合物 (II'-b) またはその塩のうち、基  $R^{1*}$  が水素原子を示す化合物 (II'-b-1) またはその塩は、化合物 (I-b-1) もしくはその塩のうち、基  $R^1$  が式

CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>（式中の記号は前記と同意義を示す。）で表される基を示す化合物、即ち式



- 5 [式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩、または化合物 (I-d) もしくはその塩のうち、基 R<sup>1</sup>が式 CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>（式中の記号は前記と同意義を示す。）で表される基を示す化合物、即ち式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物もしくはその塩の合成中間体である。

- 10 化合物 (II'-a) またはその塩のうち、基 R<sup>1\*</sup>がベンジル基を示す化合物 (II'-a-2) またはその塩は、化合物 (II'-a-1) またはその塩の合成中間体であり、化合物 (II'-b) またはその塩のうち、基 R<sup>1\*</sup>がベンジル基を示す化合物 (II'-b-2) またはその塩は、化合物 (II'-b-1) またはその塩の合成中間体である。

- 15 また化合物 (II'-a) またはその塩のうち、基 R<sup>1\*</sup>がtert-ブチル基を示す化合物 (II'-a-3) またはその塩は、化合物 (I-a-1r) もしくはその塩または化合物 (I-c-r) もしくはその塩の合成中間体であり、化合物 (II'-b) またはその塩のうち、基 R<sup>1\*</sup>がtert-ブチル基を示す化合物 (II'-b-3) またはその塩は、化合物 (I-b-1r) もしくはその塩または化合物 (I-d-r) もしくはその塩の合成中間体である。

- 20 化合物 (II'-a-1)、(II'-a-2)、(II'-a-3)、(II'-b-1)、(II'-b-2) 及び (II'-b-3) の塩としては、上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いら

れる。

本願明細書の以下の部分において上記した本発明の化合物 (II'-a-1)、(II'-a-2)、(II'-a-3)、(II'-b-1)、(II'-b-2) 及び (II'-b-3) を総称して本発明化合物 (II') と呼称することがある。

5      なお上記一般式 (II) または (II') で表される化合物が 1 個以上の不斉中心を有する場合、一般式 (II) または (II') で表される化合物には 2 個以上の立体異性体 (例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー等) が存在するが、一般式 (II) または (II') にはこれらの立体異性体のすべて及びそれらのうちの任意の 2 個以上からなる混合物が包含されている。

10      また上記一般式 (II) または (II') で表される化合物が二重結合等に関する幾何異性を有する場合、一般式 (II) または (II') で表される化合物には 2 個以上の幾何異性体 (例えば、E/Z または トランス/シスの各異性体、S-トランス/S-シスの各異性体等) が存在するが、一般式 (II) または (II') にはこれらの幾何異性体のすべて及びそれらのうちの任意の 2 個以上からなる混合物が包含されている。

15      本発明の化合物 (I) またはその塩は、安全性に優れた除草剤として有用であり、極めて低薬量で広範囲の雑草、例えば、タイヌビエ、ヒメタイヌビエ、タマガヤツリ、コゴメガヤツリ、ヒデリコ、マツバイ、イヌホタルイ、タイワンヤマイ、ミズガヤツリ、クログワイ、コウキヤガラ、シズイ、コナギ、アゼナ、アブ  
20      ノメ、キカシグサ、ヒメミソハギ、ミゾハコベ、チョウジタデ、ウリカワ、ヘラオモダカ、オモダカ、ヒルムシロ、セリ、ミズハコベ、アゼトウガラシ、タカサ  
    ブロウ、イボクサ、キシウスズメノヒエ、エゾノサヤヌカグサ等の水田雑草、  
    メヒシバ、エノコログサ、ヒメイヌビエ、オオクサキビ、セイバンモロコシ、カ  
25      ラスムギ、ブラックグラス、ウマノチャヒキ、ハマスゲ、アオビユ、イチビ、アカザ、イヌタデ、スベリヒユ、アメリカキンゴジカ、シロバナチョウセンアサガ  
    オ、マルバアサガオ、オナモミ、コハコベ、カラシナ類、エビスグサ、カミツレ、  
    ツユクサ等の畑地雑草に対して優れた殺草力を有するのみならず、イネ、コムギ、  
    オオムギ、ダイズ、トウモロコシ、ワタ等の作物に対して薬害はほとんどなく、  
    高い安全性を示す。化合物 (I) またはその塩は、作物と各種雑草との間に優れ

た選択的除草効果を示し、哺乳動物や魚介類に対して低毒性で、環境を汚染することもなく、水田、畑、芝生、果樹園あるいは非農耕地用の除草剤として極めて安全に使用することができる。なかでも水田で使用する除草剤として適している。

本発明の化合物 (I) またはその塩を除草剤として使用するにあたっては、一般の農薬のとりうる形態、すなわち、化合物 (I) またはその塩の 1 種または 2 種以上（好ましくは 1～3 種）を使用目的によって適当な液体担体に溶解するか分散させるか、または適当な固体担体と混合するか吸着させ、乳剤、液剤、油剤、粉剤、DL（ドリフトレス）型粉剤、粒剤、微粒剤、微粒剤 F、細粒剤 F、水和剤、顆粒水和剤、水溶剤、フロアブル剤、錠剤、ジャンボ剤、噴霧剤、ペースト剤等の製剤として使用する。これらの製剤は必要に応じ、乳化剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、結合剤、増粘剤等を添加してもよく、自体公知の方法で調製することができる。

使用する液体担体（溶剤）としては、例えば、水、アルコール類（例、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例、アセトン、メチルエチルケトン等）、エーテル類（例、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等）、脂肪族炭化水素類（例、ケロシン、灯油、燃料油、機械油等）、芳香族炭化水素類（例、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等）、酸アミド類（例、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、エステル類（例、酢酸エチルエステル、酢酸ブチルエステル、脂肪酸グリセリンエステル等）、ニトリル類（例、アセトニトリル、プロピオニトリル等）等の溶媒が用いられる。これらは 1 種または 2 種以上（好ましくは 1～3 種）を適当な割合で混合して使用する。

固体担体（希釈・増量剤）としては、例えば、植物性粉末（例、大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等）、鉱物性粉末（例、カオリン、ベントナイト、酸性白土、クレイ等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等）、アルミナ、硫黄粉末、活性炭、糖類（例、乳糖、ブドウ糖等）、無機



塩類（例、炭酸カルシウム、重炭酸ナトリウム等）、ガラス中空体（天然のガラス質を焼成加工してその中に気泡を内包させたもの）等が用いられる。これらは1種または2種以上（好ましくは1～3種）を適当な割合で混合して使用する。

- 5 該液体担体または固体担体は、製剤全体に対して通常約1～99重量%程度、好ましくは約10～99重量%程度用いることができる。

乳化剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤等としては必要に応じて界面活性剤が用いられる。これらの界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル（例、三洋化成工業（株）製、エマルミン110等）、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル（例、三洋化成（株）製、ノニポール85、  
10 ノニポール100、ノニポール160等）、ポリオキシエチレンラノリンアルコール、ポリオキシエチレンアルキルフェノールホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル（例、花王（株）製、トウイーン20、トウイーン80、第一工業製薬（株）製、ソルゲンTW-20、ソルゲンTW-80等）、ポリオキシエチレングリセリルモノ脂肪酸エステル、ポリオキシプロピレン  
15 グリコールモノ脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビトール脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンヒマシ油誘導体、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、高級脂肪酸グリセリンエステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、アルキロールアミド、ポリオキシエチレンアルキルアミン等の非イオン性界面活性剤、アルキルアミン塩酸塩（例、ドデシルアミン塩酸塩等）、アルキル四級アンモニウム塩、アルキルトリメチル四級アンモニウム塩  
20 （例、ドデシルトリメチルアンモニウム塩等）、アルキルジメチルベンジルアンモニウム塩、アルキルピリジニウム塩、アルキルイソキノリニウム塩、ジアルキルモルホリニウム塩、塩化ベンゼトニウム、ポリアルキルビニルピリジニウム塩  
25 等のカチオン性界面活性剤、高級脂肪酸ナトリウム塩（例、パルミチン酸ナトリウム等）、エーテルカルボン酸ナトリウム塩（例、ポリオキシエチレンラウリルエーテルカルボン酸ナトリウム等）、高級脂肪酸のアミノ酸縮合物（例、ラウロイルサルコシンナトリウム、N-ラウロイルグルタミン酸ナトリウム等）、高級アルキルスルホン酸塩、高級脂肪酸エステルスルホン酸塩（例、ラウリン酸エス

テルスルホン酸塩等)、リグニンスルホン酸塩(例、リグニンスルホン酸ナトリウム等)、アルキルスルホサクシネート(例、ジヘプチルスルホコハク酸ナトリウム、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、ジノニルスルホコハク酸ナトリウム等)、高級脂肪酸アミドスルホン酸塩(例、オレイン酸アミドスルホン酸塩等)、  
5     )、ドデシルベンゼンスルホン酸塩、ジイソプロピルナフタレンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩ホルマリン縮合物、高級アルコール硫酸エステル塩(例、ペンタデカン-2-イルスルフェート等)、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩(例、ポリオキシエチレンドデシルエーテル硫酸ナトリウム等)、ポリオキシエチレンアルキルリン酸エステル(例、ジポリオキシエチレンドデシルエーテルリン酸エステル等)、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、スチレン-マレイン酸共重合体、アルキルビニルエーテル-マレイン酸共重合体等のアニオン性界面活性剤、N-ラウリルアラニン、N, N, N-トリメチルアミノプロピオン酸、N, N, N-トリヒドロキシエチルアミノプロピオン酸、N-ヘキシル-N, N-ジメチルアミノ酢酸、1-(2-カルボキシエチル)ピリジニウムベタイン等の両性界面活性剤等があげられる。これらのうち1種または2種以上(好ましくは1~5種)が用いられる。該界面活性剤は、製剤全体に対して通常約0.1~50重量%程度、好ましくは約0.1~25重量%程度用いることができる。

結合剤としては、例えば、デキストリン(例、日澱化学(株)製、デキストリンND-S等)、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩(例、第一工業製薬(株)製、セロゲン5A、セロゲン6A、セロゲン7A、セロゲンPR等)、ポリカルボン酸系高分子化合物(例、三洋化成工業(株)製、トキサノンGR-30、トキサノンGR-31A、トキサノンGR-50L、トキサノンGR-60L;花王(株)製、ポイズ530、ポイズ532A等)、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、リグニンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸カルシウム、ポリアクリル酸ナトリウム、アラビアガム、アルギン酸ナトリウム、グルコース、ショ糖、マンニトール、ソルビトール等が用いられる。該結合剤は、製剤全体に対して通常約0~20重量%程度用いることができる。

増粘剤としては、例えば、ベントナイト鉱物質(例、高純度ソジウムモンモリ

ロナイト等)、ポリアクリル酸とその誘導体、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩(例、第一工業製薬(株)製、セロゲン5A、セロゲン6A、セロゲン7A、セロゲンPR等)、ホワイトカーボン類、天然の糖類誘導体(例、キサンタンガム、グアーガム等)等が用いられる。該増粘剤は製剤全体に対して通常  
5 約0.01~10重量%程度用いられる。

本発明の化合物(I)またはその塩を除草剤として使用するための製剤形態としては粒剤、フロアブル剤が好ましく、粒剤の中では水面浮遊性粒剤、フロアブル剤の中では水性懸濁剤が特に好ましい。本発明は本発明の化合物(I)またはその塩を含有する水面浮遊性粒剤及び水性懸濁剤にも関する。

10 本発明の水面浮遊性粒剤においては、通常、担体として比重が1以下の粉末基剤が用いられる。これらの粉末基剤としては、その粒子径が600 $\mu$ m以下、好ましくは300 $\mu$ m以下であるものがよく、無機物では、上記に示したガラス中空体、即ち天然のガラス質を焼成加工することによりその中に独立した1個または複数個の気泡を有するものであり、例えば、真珠岩や黒曜石からなるパーライト、シラスよりなるシラスバルーン、蛭石よりなるバーミキュライト等や、アル  
15 ミノシリケート系で同じく焼成加工することにより得られる微小中空球体のフィライト等があげられる。また有機物では、一般にロウ状物質と呼ばれる常温で固体の高級脂肪酸(例、ステアリン酸、パルミチン酸等)、高級アルコール(例、ステアリルアルコール等)、パラフィンワックス、ポリエチレン粉末(例、三  
20 洋化成工業(株)製、サンワックス131-P、サンワックス151-P、サンワックス161-P、サンワックス171-P等)、ポリプロピレン粉末(例、三洋化成工業(株)製、ビスコール330-P、ビスコール550-P、ビスコール660-P等)等があげられる。好ましくはガラス中空体であり、特に好ましくはパーライトである。該比重が1以下の粉末基剤は製剤全体に対して通常約1  
25 0~90重量%程度、好ましくは約30~90重量%程度用いることができる。

本発明の水面浮遊性粒剤においては、通常、界面張力低下能の大きい界面活性剤が用いられる。これらの界面活性剤としては、水の表面張力を25℃で35 dyne/cm以下に低下させることができるものが用いられ、例えば、アルキルベンゼンスルホネート、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチ

レンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル  
サルフェート、アルキルスルホサクシネート（例、第一工業製薬（株）製、ネオ  
コールYS-K、ネオコールSW-CE；竹本油脂（株）製、ニューカルゲンE  
P-70G；東邦化学（株）製、エアロールCT-1；三洋化成工業（株）製、  
5 サンモリンOT-70等）、アセチレングリコール（例、エア・プロダクツ社製、  
サーフィノール104、サーフィノール104A、サーフィノール104E、サー  
フィノール104H、サーフィノールTG、サーフィノールTG-E、サーフ  
ィノールPC、サーフィノール61、サーフィノール82、サーフィノール40、  
サーフィノール465；日信化学（株）製、オルフィンE1010等）等があげ  
10 られるが、これらに限定されるものではなく、単独で、あるいは必要に応じて2  
種以上を任意の割合で混合してもよい。これらのうち、特にアルキルスルホサ  
クシネート及びアセチレングリコール系界面活性剤が好ましい。該界面張力低下能  
の大きい界面活性剤は製剤全体に対して通常約0.1～20重量％程度、好まし  
くは約1～10重量％程度用いることができる。

15 本発明の水面浮遊性粒剤においては、通常、結合剤が用いられる。これらの結  
合剤としては、上記の結合剤があげられ、これらのうち1種または2種以上（好  
ましくは1～3種）を用いる。好ましくはカルボキシメチルセルロースまたはそ  
の塩（例、ナトリウム塩）及びポリカルボン酸系高分子化合物である。該結合剤  
は製剤全体に対して通常約0.1～20重量％程度、好ましくは約1～20重量  
20 ％程度用いることができる。

本発明の水面浮遊性粒剤においては、必要に応じて有機溶剤を含有せしめるこ  
とができる。これらの有機溶剤としては、例えば、フタル酸エステル（例、フタ  
ル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル、フタル酸ジトリデシル等のフタル酸ジC<sub>1</sub>  
-<sub>20</sub>アルキルエステル等）、脂肪族モノカルボン酸エステル（例、パルミチン酸  
25 エチル、ラウリン酸メチル等）、脂肪族ジカルボン酸エステル（例、コハク酸ジ  
オクチル等）等のエステル類、キシレン、エチルベンゼン、オクタデシルベンゼ  
ン、ソルベッソシリーズ（例、エクソン化学製、ソルベッソ100、ソルベッソ  
150、ソルベッソ200等）、メチルナフタレン（例、川崎化成工業（株）製、  
カワカゾール等）、ドデシルナフタレン、トリデシルナフタレン、SAS-31

0（日本石油化学（株）製）等の芳香族炭化水素、オレイン酸、デカン酸、ヘプタン酸等の脂肪酸、オリーブ油、大豆油、菜種油、アマニ油、綿実油、パーム油、アボガド油、サメ肝油等の動植物油、マシン油等の鉱物油等の高沸点有機溶剤等があげられ、これらのうち1種または2種以上（好ましくは5種以下）を組み合わせ使用する。なかでもカワカゾールが好ましい。該有機溶剤は製剤全体に対して通常約0.1～30重量％程度、好ましくは約1～30重量％程度用いることができる。

本発明の水面浮遊性粒剤においては、更に湿潤剤、乳化剤または分散剤として界面活性剤を添加してもよい。これらの界面活性剤としては、上記の界面活性剤  
10 があげられ、好ましくはポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックポリマー（例、三洋化成工業（株）製、ニューポールPE-68、ニューポールPE-64等）等が用いられる。該界面活性剤は製剤全体に対して通常約0.1～30重量％程度、好ましくは約0.1～20重量％程度用いることができる。

本発明の水面浮遊性粒剤においては所望により粒剤としての見かけ比重が1以下になる範囲で増量剤を適量加えてもよい。この増量剤としては、有効成分の水  
中への分散を促進するかもしれないものが好ましく、水溶性あるいは水分  
散性であるものが望ましい。例えば、水溶性肥料（例、尿素、硫酸アンモニウム、  
塩化アンモニウム、塩化カリウム等）、水可溶性の糖（例、乳糖、ブドウ糖等）、  
無機塩（例、炭酸カルシウム、重炭酸ナトリウム等）、鉱物質微粉（例、ベント  
ナイト、ジークライト、酸性白土、珪藻土等）等をあげることができるが、これ  
らに限定されるものではない。増量剤の配合量は製剤全体に対して通常50重量  
%以下である。

本発明の水面浮遊性粒剤は、まず、本発明の化合物（I）またはその塩、必要により、比重が1以下の粉末基剤、界面活性剤、結合剤、有機溶剤、他の除草活性成分、さらに所望により、他の農薬活性成分、増量剤などを混合し、練合して製造する。例えば、通常の湿式法と同様に上記の構成成分を、通常よく使用される混合機、例えばリボンブレンダーやV型混合機に投入し、よく混合した後、ニーダーに移し水を加え練合してから押しだし造粒機により造粒し、粒径0.5～5mmの粒剤を得る。

このようにして製造される本発明の水面浮遊性粒剤は、水面での拡散性が良好であり、水田等に散布した場合は、水面全体に均一に農薬活性成分が分散するため、イネ等の栽培作物に対して薬害が実質的になく、また、動物や魚介類に対しても施用時または施用後に害は実質的にはなく、安全に使用できる。

- 5       また本発明の水面浮遊性粒剤は散布に際して簡便なように、20～200gの単位で水溶性フィルムに包装してもよい。該水溶性フィルムとしては、例えば、ポリビニルアルコール、カルボキシメチルセルロース、デンプン、ゼラチン、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸及びその塩、デンプン系多糖類（例、林原商事、プルラン等）、熱可塑性水溶性ポリマー（例、第一工業製薬（株）製、パ  
10       オゲン等）等があげられ、これらのうちの1種または2種以上の混合物が用いられる。さらに木材パルプを混合したものでもよい。いずれの場合においても水に対する溶解または分散の速いフィルムを選ぶのがよい。

- 本発明による水面浮遊性粒剤は水面に投下したとき、その見掛け比重が1以下の  
15       ために沈まないが、界面張力低下能の大きい界面活性剤を含んでいるので、粒剤中にすばやく水が侵入すると同時に、界面活性剤が溶けだし、粒のまわりの水の表面張力は低下し、粒は水面上を投下地点より外側に引っ張られ、粒同士の間隔はみるみる広がると同時に、崩壊し始めるが、本発明の水面浮遊性粒剤の内部に均一に界面活性剤が含まれているので、一次粒子（凝集していない粒を構成する最小単位）になるまで、水面で拡張と崩壊を続け、比重が1以上の農薬活性成分等は水中に分散してゆき、最後には比重が1以下の粉末基剤のみが水面に残る。  
20       この際、水面浮遊性粒剤は表面張力の差により崩壊する程度の崩壊性を有するように、その硬度を調整することが望ましい。かくして、農薬活性成分は水田全体にむらなく行き渡ることになる。このような水面浮遊性粒剤の拡張、崩壊、分散は、極めて瞬時に起こるので、散布時の風の影響による農薬活性成分の水田での  
25       偏りや、薬害の心配もない。

      本発明の水性懸濁剤には湿潤剤または分散剤として界面活性剤を添加してもよい。これらの界面活性剤としては、上記の界面活性剤があげられ、好ましくはアルキルスルホサキシネート（例、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム（例えば、第一工業製薬（株）製、ネオコールYS-K等）等）、ポリオキシエチレンアル

キルアリールリン酸エステル塩（例、花王（株）製、アグリゾールFL-2017等）等が用いられる。該界面活性剤は製剤全体に対して通常約0.1～20重量%程度、好ましくは約0.1～10重量%程度用いることができる。

5 本発明の水性懸濁剤には必要に応じて凍結防止剤、消泡剤、防腐剤、増粘剤を添加してもよい。凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、プロピレングリコール等があげられ、製剤全体に対して通常約1～20重量%程度用いることができる。消泡剤としては、例えば、アンチフォームE-20（花王（株）製）等があげられ、製剤全体に対して通常約0.05～0.5重量%程度用いることができる。防腐剤としては、例えば、p-ヒドロキシ安息香酸ブチル、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム等があげられ、製剤全体に対して通常約0.05～3重量%程度用いることができる。増粘剤としては上記の増粘剤があげられ、好ましくは高純度ソジウムモンモリロナイト（例、クニミネ工業（株）製、クニピ  
10 アF等）が用いられる。該増粘剤は製剤全体に対して通常約0.01～10重量%程度用いることができる。

15 本発明の水性懸濁剤は、自体公知の方法あるいはそれに準ずる方法に従い、本発明の化合物（I）またはその塩、必要により、界面活性剤、他の除草活性成分、さらに所望により、他の農薬活性成分、凍結防止剤、消泡剤、防腐剤、増粘剤などを、水に溶解、あるいは懸濁させることによって製造できる。例えば、使用する全成分を攪拌機により攪拌混合した後、ダイノミルまたはマイクロフルイダイ  
20 ザー等の湿式粉碎機で微粉碎および分散する方法（製法1）か、または有効成分の除草剤等の原末等をジェットマイザーのような乾式粉碎機により粉碎し、他の成分を高速攪拌機により混合して分散させる方法（製法2）が挙げられる。本発明の水性懸濁剤の有効成分は、製剤中微粒子の形となり、水中に分散することになる。他の粉末成分が用いられるときも同様に水中に分散する。微粒子の平均粒  
25 径は約10 $\mu$ m以下、好ましくは0.1～5 $\mu$ mである。

このようにして製造される本発明の水性懸濁剤は、水中での拡散性が良好であり、水中に均一に農薬活性成分が分散するため、イネ等の栽培作物に対して薬害が実質的になく、また、動物や魚介類に対しても施用時または施用後に害は実質的にはなく、安全に使用できる。

本発明の化合物 (I) またはその塩の製剤中の含有割合は乳剤、水和剤、顆粒水和剤、液剤、水溶剤、フロアブル剤等では約 1 ~ 90 重量%程度が適当であり、油剤、粉剤、DL型粉剤等では約 0.01 ~ 10 重量%程度が適当であり、微粒剤、微粒剤F、細粒剤F、粒剤等では約 0.05 ~ 10 重量%程度が適当であるが、使用目的によってはこれらの濃度を適宜変更してもよい。乳剤、水和剤、顆粒水和剤、液剤、水溶剤、フロアブル剤等では使用に際して水等で適宜希釈増量（例えば、約 100 ~ 100,000 倍）して散布することもできる。

施用方法は通常の農薬の施用方法と同様の方法を用いることができ、例えば、空中散布、土壌散布、茎葉散布、育苗箱散布、側条施用、種子処理等があげられる。例えば水田に施用する場合には自体公知の方法（例、手撒き、動力散布等）により施用される。

本発明の化合物 (I) またはその塩を除草剤として用いる場合の使用量は、適用場面、適用時期、施用方法、対象草種、栽培作物等により差異はあるが、一般に有効成分（化合物 (I) またはその塩）として水田 1 アールあたり 0.05 ~ 50 g 程度、好ましくは 0.1 ~ 10 g 程度、畑地 1 アールあたり 0.05 ~ 50 g 程度、好ましくは 0.1 ~ 10 g 程度である。

本発明の化合物 (I) またはその塩は水田雑草用としては、出芽前土壌処理あるいは茎葉兼土壌処理剤として使用するのが適当である。例えば、本発明の化合物 (I) またはその塩を含有する除草剤は田植え直後あるいは田植え 1 ~ 3 週間後でも薬害を発現することなく安全に使用でき、長期にわたって効果が持続する。

本発明の化合物 (I) またはその塩を含有する除草剤は、必要に応じて、1 種または 2 種以上（好ましくは 1 ~ 3 種）の他の除草剤、植物生長調節剤、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤等と同時に施用することができる。また該 1 種または 2 種以上（好ましくは 1 ~ 3 種）の他の除草剤、植物生長調節剤、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤等を配合し、混合使用することもできる。

他の除草剤（除草活性成分）としては、例えば、(1) スルホニル尿素系除草剤[ベンスルフロンメチル(bensulfuron-methyl)、ピラゾスルフロンエチル(pyrazosulfuron-ethyl)、イマゾスルフロン(imazosulfuron)、スルホスルフロン(sulfosulfuron)、シノスルフロン(cinosulfuron)、アジムスルフロン(azimsulfuron)



)、メトスルフロンメチル(metsulfuron-methyl)、ハロスルフロンメチル(halosulfuron-methyl)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron)、シクロスルファムロン(cyclosulfamuron)等]、(2)ピラゾール系除草剤[ピラゾレート(pyrazolate)、ピラゾキシフェン(pyrazoxyfen)、ベンゾフェナップ(benzofenap)等]、(3)カーバメート系除草剤[ベンチオカーブ(benthiocarb)、モリネート(molinate)、エスプロカルブ(esprocarb)、ピリブチカルブ(pyributicarb)、ジメピペレート(dimepiperate)、スエップ(swep)等]、(4)クロロアセトアニリド系除草剤[ブタクロール(butachlor)、プレチラクロール(pretilachlor)、テニルクロール(thenylchlor)等]、(5)ジフェニルエーテル系除草剤[クロメトキシニル(chlomethoxynil)、ビフェノックス(bifenox)、CNP等]、(6)トリアジン系除草剤[シメトリン(simetryn)、ジメタメトリン(dimethametryn)、プロメトリン(prometryn)等]、(7)フェノキシ酸系除草剤[2, 4-PA、MCP、MCPB、フェノチオール(phenothiol)等]、(8)酸アミド系または尿素系除草剤[プロパニル(propanil)、メフェナセット(mefenacet)、クロメプロップ(clomeprop)、ナプロアニリド(naproanilide)、ブロモブチド(bromobutide)、ダイムロン(daimuron)、クミルロン(cumyluron)、エトベンザニド(etobenzanid)、3-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-2, 3-ジヒドロ-6-メチル-5-フェニル-4H-1, 3-オキサジン-4-オン(3-(1-(3, 5-dichlorophenyl)-1-methylethyl)-2, 3-dihydro-6-methyl-5-phenyl-4H-1, 3-oxazin-4-one)等]、(9)有機リン系除草剤[ベンスリド(bensulide)、ピペロホス(piperophos)、ブタミホス(butamifos)、アニロホス(anilofos)等]、(10)ジニトロアニリン系除草剤[トリフルラリン(trifluralin)、プロジアミン(prodiamine)等]、(11)その他の系統の除草剤[ベントazon(bentazon)、ベンフレセート(benfuresate)、オキサジアゾン(oxadiazon)、オキサジアルギル(oxadiargyl)、ペントキサゾン(pentoxazone)、シハロホップブチル(cyhalofop-butyl)、カフェンストロール(cafenstrole)、ピリミノバックメチル(pyriminobac-methyl)、ビスピリバックナトリウム(bispyribac-sodium)、ピリベンゾキシム(pyribenzoxim)、7-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルチオ)-3-メチルフタリド(7-(4, 6-dimethoxyprymidin-2-ylthio)-3-methylphthalide)、1-(2-クロロフェニル)-

4 - (N-シクロヘキシル-N-エチルカルバモイル) - 5 (4H) - テトラゾ  
 リノン(1-(2-chlorophenyl)-4-(N-cyclohexyl-N-ethylcarbamoyl)-5(4H)-tetrazo  
 linone)、2 - (2 - (3-クロロフェニル) - 2, 3-エポキシプロピル) -  
 2-エチルインダン-1, 3-ジオン(2-(2-(3-chlorophenyl)-2,3-epoxypropyl  
 5 )-2-ethylindane-1,3-dione)、ACN、3 - (2-クロロ-4-メチルスルホニ  
 ルベンゾイル) - 4-フェニルチオビスクロ[3.2.1]オクト-3-エン-2  
 -オン(3-(2-chloro-4-methylsulfonylbenzoyl)-4-phenylthiobicyclo[3.2.1]oct  
 -3-en-2-one)、ジチオピル(dithiopyr)、ダラポン(dalapon)、クロルチアミド(c  
 hlorthiamid)等]等があげられる。

10 植物生長調節剤(植物生長調節活性成分)としては、例えば、ヒメキサゾール  
 (hymexazol)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、ウニコナゾール-P(unico  
 nazole-P)、イナベンフィド(inabenfide)、プロヘキサジオンカルシウム(prohex  
 adione-calcium)等があげられる。

殺菌剤(殺菌活性成分)としては、例えば、(1) ポリハロアルキルチオ系殺  
 15 菌剤[キャプタン(captan)等]、(2) 有機リン系殺菌剤[IBP、EDDP、ト  
 ルクロフォスメチル(tolclofos-methyl)等]、(3) ベンズイミダゾール系殺菌  
 剤[ベノミル(benomyl)、カルベンダジム(carbendazim)、チオフアネートメチル(  
 thiophanate-methyl)等]、(4) カルボキシアミド系殺菌剤[メプロニル(mepro  
 nil)、フルトラニル(flutolanil)、チフルザミド(thifluzamid)、フラメトピル(f  
 20 urametpyr)、テクロフタラム(teclofthalam)、ペンシクロン(pencycuron)、カル  
 プロパミド(carpropamid)、ジクロシメット(diclocymet)等]、(5) アシルアラ  
 ニン系殺菌剤[メタラキシル(metalaxyl)等]、(6) アゾール系殺菌剤[トリフル  
 ミゾール(triflumizole)、イプコナゾール(ipconazole)、ペフラゾエート(pefur  
 azoate)、プロクロラズ(prochloraz)等]、(7) メトキシアクリル酸系殺菌剤[  
 25 アゾキシストロビン(azoxystrobin)、メトミノストロビン(metominostrobin)等]、  
 (8) 抗生物質系殺菌剤[バリダマイシンA(validamycin A)、ブラストサイジン  
 S(blasticidin S)、カスガマイシン(kasugamycin)、ポリオキシシン(polyoxin)等  
 ]、(9) その他の殺菌剤[フサライド(fthalide)、プロベナゾール(probenazole  
 )、イソプロチオラン(isoprothiolane)、トリシクラゾール(tricyclazole)、ピ

ロキロン(pyroquilon)、フェリムゾン(ferimzone)、アシベンゾラルSメチル(ac ibenzolar S-methyl)、ジクロメジン(diclomezine)、オキシリニック酸(oxolinic acid)、フェナジンオキシド(phenazine oxide)、TPN、イプロジオン(iprodione)等]等があげられる。

- 5 殺虫剤(殺虫活性成分)としては、例えば、(1)有機リン系殺虫剤[フェンチオン(fenthion)、フェントロチオン(fenitrothion)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ダイアジノン(diazinon)、キナルホス(quinalphos)、イソキサチオン(isoxathion)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、バミドチオン(vamidothion)、マラチオン(malathion)、フェントエート(phenthoate)、ジメトエート(dimethoate)、ジスルホトン(10 disulfoton)、モノクロトホス(monocrotophos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、プロパホス(propaphos)、アセフェート(acephate)、トリクロルホン(trichlorphon)、EPN、ピラクロホス(pyraclofos)等]、(2)カルバメート系殺虫剤[カルバリル(carbaryl)、15 メトルカルブ(metolcarb)、イソプロカルブ(isoprocab)、BPMC、プロボキスル(propoxur)、XMC、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、メソミル(methomyl)、チオジカルブ(thiodicarb)等]、(3)合成ピレスロイド系殺虫剤[シクロプロトリン(cycloprothrin)、エトフェンプロックス(ethofenprox) 20 等]、(4)ネライストキシン系殺虫剤[カルタップ(cartap)、ベンスルタップ(bensultap)、チオシクラム(thiocyclam)等]、(5)ネオニコチノイド系殺虫剤[イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、3-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-1, 3-チアゾリジン-2-イリデンシアナミド(3-(6-chloro-3-pyridylmethyl)-1, 3-thiazolidin-2-ylidenecyanamide)、1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロフラン-3-イルメチル)グアニジン(1-methyl-2-nitro-3-(tetrahydrofuran-3-ylmethyl)guanidine)、(E)-1-(2-クロロ-1, 3-チアゾール-5-イルメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン((E)-1-(2-chloro-1, 3-thiazol-5-ylmethyl)-3-methyl-2-nitroguanidine)等]、(6)
- 25

その他の殺虫剤[ブプロフェジン(buprofezin)、テブフェノジド(tebufenozide)、フィプロニル(fipronil)等]等があげられる。

殺ダニ剤(殺ダニ活性成分)としては、例えば、ヘキシチアゾクス(hexythiaz ox)、ピリダベン(pyridaben)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、テブフ  
5 エンピラド(tebufenpyrad)、クロルフェナピル(chlorfenapyr)、エトキサゾール(etoxazole)、ピリミジフェン(pyrimidifen)等があげられる。

殺線虫剤(殺線虫活性成分)としては、例えば、フォスチアゼート(fosthiazate)等があげられる。

このような他の農薬活性成分(例、除草活性成分、植物生長調節活性成分、殺  
10 菌活性成分、殺虫活性成分、殺ダニ活性成分、殺線虫活性成分など)は製剤全体に対して通常約0.1~20重量%程度、好ましくは約0.1~10重量%程度用いることができる。

本発明の化合物(I)またはその塩を含有する農薬組成物を、上記したような  
15 他の農薬活性成分と組み合わせて用いる場合、他の農薬活性成分を化合物(I)またはその塩を含有する製剤と同一の製剤に混合、配合し、使用することができ、またそれぞれの活性成分を別個に製剤化したものを同時に、もしくは時間差をおいて別々に使用してもよい。

例えば、化合物(I)またはその塩および他の除草活性成分を含有する農薬組成物としては上記したような水面浮遊性粒剤、水性懸濁剤とするのが好ましい。

20 このような他の除草活性成分としてはとりわけイマゾスルフロンが好ましく用いられる。

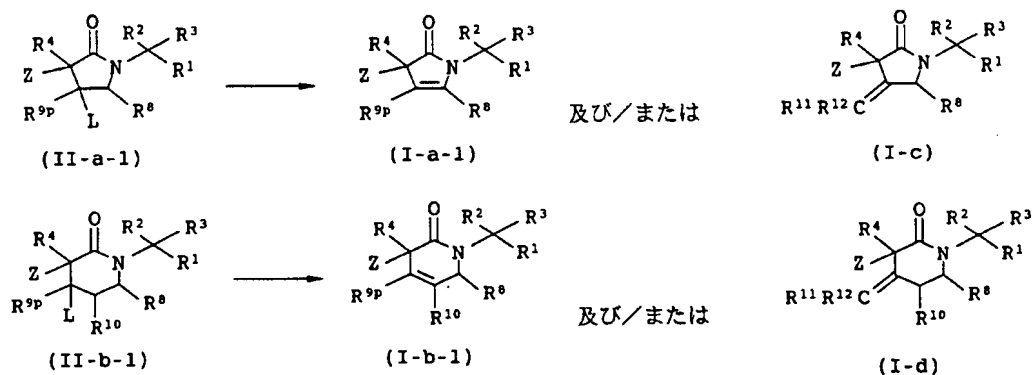
本発明の化合物(I)またはその塩を含有する除草剤には、更に共力剤(例、  
25 ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)等)、誘引剤(例、オイゲノール(eugenol)等)、忌避剤(例、クレオソート(creosote)等)、色素(例、食用青色1号等)、肥料(例、尿素等)等を適宜混合してもよい。

本発明の化合物(I)またはその塩は新規な化合物であるが、自体公知の方法あるいはそれに準じる方法に従って製造することができる。

詳しくは化合物(I)またはその塩のうち、化合物(I-a-1)、(I-c)、(I-b-1)、(I-d)またはそれらの塩は以下の反応図式1に従って製造することがで

きる。

反応図式 1



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 5 本反応においては化合物 (II-a-1)、(II-b-1) またはそれらの塩を脱離反応に付し、脱離基 L 及び隣接する炭素原子上の水素原子を脱離させる。本脱離反応では原料化合物である化合物 (II-a-1) から基 R<sup>8</sup> が結合した炭素原子上の水素原子及び基 L が脱離して生成する化合物 (I-a-1) が通常得られるが、基 R<sup>9p</sup> が脱離反応に関与する水素原子を有する場合、即ち基 R<sup>11</sup> R<sup>12</sup> CH に該当する場合
- 10 にはこの水素原子及び基 L が脱離して生成する化合物 (I-c) も得られることがある。化合物 (II-b-1) を原料化合物とする場合も同様に基 R<sup>10</sup> が結合した炭素原子上の水素原子及び基 L が脱離して生成する化合物 (I-b-1) が通常得られるが、基 R<sup>9p</sup> が基 R<sup>11</sup> R<sup>12</sup> CH に該当する場合にはこの基の上の水素原子及び基 L が脱離して生成する化合物 (I-d) も得られることがある。
- 15 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1、2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、o-ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン (以下、THF と略記する)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル等のニトリル類、アセトン、
- 20 メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、N、N-ジメチルホルムアミド (以下、DMF と略記する)、N、N-ジメチルアセトアミド (以下、DMA と略記する)、ジメチルスルホキシド (以下、DMSO と略記する) 等の非プロトン性極性溶媒類、ま

たはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応においては反応を加速させるために塩基を添加することもできる。本反応に用いられる塩基としては例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジン、コリジン、ルチジン、1, 8-ジアザ  
5 ビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン（以下、DBUと略記する）、1, 4-  
ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノ  
ン-5-エン等の有機塩基類、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリ  
ウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類、ナトリウムメトキシド、  
10 ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド類等が  
用いられる。塩基は化合物(II-a-1)または(II-b-1)に対して通常1~20モ  
ル当量用いられる。またピリジン等の有機塩基を溶媒として用いることも可能で  
ある。

本反応の原料化合物である化合物(II-a-1)または(II-b-1)のうち、脱離基  
となる基Lとしてヒドロキシ基を有する化合物(II-a-1')または(II-b-1')を  
15 用いる場合には、塩化チオニル、オキシ塩化リン、トリフェニルホスフィン-四  
塩化炭素の組み合わせ、トリフルオロメタンスルホン酸無水物等の反応剤を通常  
1モル当量以上（好ましくは1~35モル当量）の量で添加し、反応混合物中に  
基Lとしてハロゲン原子、-OS(O)Cl基、式-OS(O)<sub>2</sub>R<sup>18</sup>（R<sup>18</sup>は  
前記と同意義を示す。）で表される基等のより脱離性の高い置換基を有する化合  
20 物を生成させて本脱離反応を行うことができる。

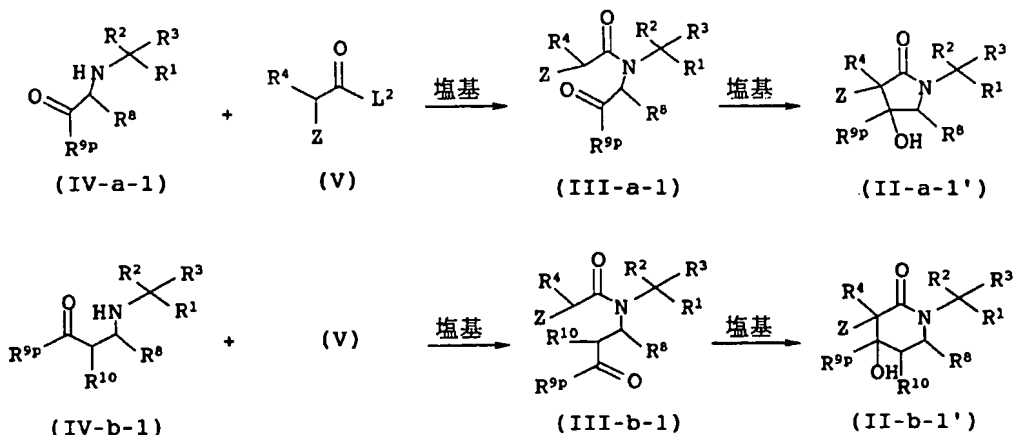
本反応の反応温度は通常約-20~150℃、好ましくは約0~100℃であ  
る。本反応は30分~30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、  
高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式1の原料化合物である化合物(II-a-1)、(II-b-1)またはそれらの  
25 塩のうち、脱離基Lとしてハロゲン原子、または式-OS(O)<sub>2</sub>R<sup>18</sup>（R<sup>18</sup>は  
前記と同意義を示す。）で表される基を有する化合物またはそれらの塩は、基L  
としてヒドロキシ基を有する化合物(II-a-1')、(II-b-1')またはそれらの塩  
から公知の方法またはそれに準じる方法に従って容易に製造することができる。  
化合物(II-a-1')、(II-b-1')またはそれらの塩から得られる、基Lとしてハ

ロゲン原子、または式 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^{18}$  ( $\text{R}^{18}$ は前記と同意義を示す。)で表される基を有する化合物またはそれらの塩は一旦単離した後反応図式1の反応に付することが可能であるが、単離せずにこれらが生成している反応混合物中で引き続き反応図式1の反応に付することも可能である。

- 5 化合物(II-a-1')、(II-b-1')またはそれらの塩は以下の反応図式2に従って製造することができる。なお下記に示す化合物(III-a-1)、(III-b-1)、(IV-a-1)、(IV-b-1)及び(V)の塩としては上記した化合物(I)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式2



10

[式中、 $\text{L}^2$ は脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$\text{L}^2$ で示される脱離基としては例えば、ハロゲン原子(例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等)または一般式

- 15  $-\text{O}-\text{CO}-\text{Q}^4$  もしくは  $-\text{O}-\text{CO}-\text{OQ}^4$

[式中、 $\text{Q}^4$ はハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~5個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)またはそれぞれハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)もしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)で1~5個置換されていてもよい(i)  $\text{C}_{6-14}$ アリール基(例、フェニル)もしくは(ii)  $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基(例、ベンジルなどのフェニル

20

—C<sub>1-4</sub>アルキル等)を示す。]で表される基(例えば、アセチルオキシ、イソブチルオキシカルボニルオキシ等)等が用いられる。なかでもハロゲン原子が好ましく、特に塩素が好適である。

5 本反応においては第1段階として化合物(IV-a-1)、(IV-b-1)またはそれらの塩を通常1モル当量以上(好ましくは1~2モル当量)の化合物(V)またはその塩と反応させて化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩を生成させ、ついで第2段階として化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩を塩基と反応させ、閉環反応を行う。化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩は新規な化合物である。

10 本反応は2段階の反応であり、第1段階の、化合物(IV-a-1)、(IV-b-1)またはそれらの塩と化合物(V)またはその塩との反応で生成する化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩を単離した後、塩基を作用させて閉環反応を行うことが可能である。また第1段階の反応で生成する化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩を単離することなく、その反応混合物中に塩基を添加  
15 することにより引き続き第2段階の反応を行うことも可能である。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、第1段階の反応に  
適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、THF、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル等のニトリル類、  
20 アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。また第2段階の反応に適当な溶媒としては第1段階の反応で用いられる溶媒と同様の溶媒が用いられる。

第1段階の反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基と  
25 しては例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、エチルジイソプロピルアミン、DBU、ピリジン等の有機塩基類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類が用いられる。これらの塩基の使用量としては化合物(IV-a-1)または(IV-b-1)に対して通常1モル当量以上(好ましくは1~2モル当量)である。

第1段階の反応の反応温度は通常約-20~150℃、好ましくは約0~10



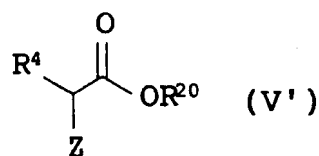
0℃である。本反応は30分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

第2段階の反応で用いられる塩基としては第1段階の反応で用いられる塩基と同様の塩基が用いられる。これらの塩基の使用量としては化合物(III-a-1)または(III-b-1)に対して通常触媒量～10モル当量程度である。また第1段階の反応で生成する化合物(III-a-1)、(III-b-1)またはそれらの塩を単離することなく、引き続き第2段階の反応を行う場合には第2段階の反応に必要な塩基を第1段階の反応の開始時に添加しておくことが可能であり、このような塩基としては第1段階で必要とされる塩基と同一のものを使用することもできる。

第2段階の反応においては反応を加速させるためにルイス酸を添加することもできる。このようなルイス酸としては例えば、四塩化チタン、塩化亜鉛、四塩化スズ、塩化アルミニウム、三フッ化ホウ素・ジエチルエーテル錯体等が用いられる。これらのルイス酸の使用量としては化合物(III-a-1)または(III-b-1)に対して触媒量～1モル当量程度である。

第2段階の反応の反応温度は通常約-20～150℃、好ましくは約0～100℃である。本反応は30分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式2の原料化合物である化合物(V)またはその塩は一般式

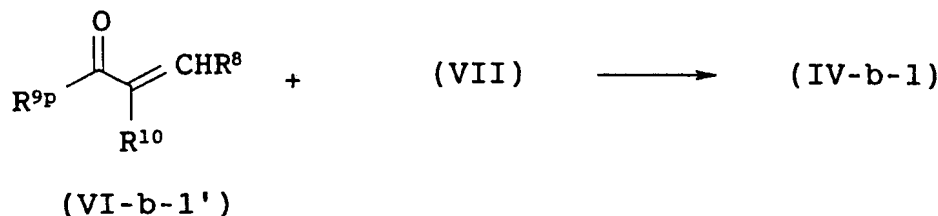
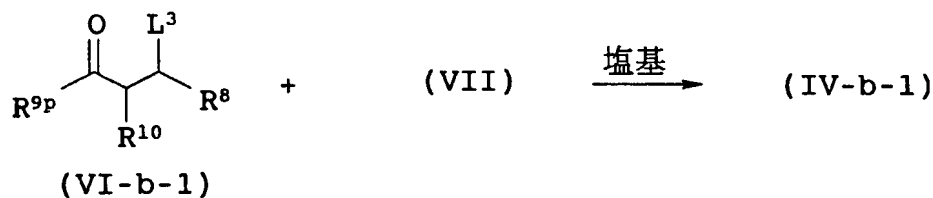
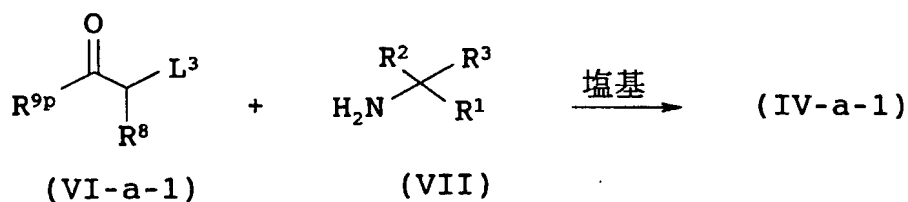


[式中、R<sup>20</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物から公知の方法またはそれに準じる方法により容易に製造することができる。R<sup>20</sup>で示されるC<sub>1-6</sub>アルキル基としては例えば、メチル、エチル、イソプロピル等が用いられる。また化合物(V')は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー[Journal of Medicinal Chemistry]第18巻、172頁(1975年)、テトラヘドロン・レターズ[Tetrahedron

Letters]第12巻、3001頁(1971年)、ケミカル・アブストラクツ[Chemical Abstracts]第55巻、25865b(1961年)、ケミカル・アブストラクツ[Chemical Abstracts]第52巻、5353a(1958年)、オーガニック・シンセシズ・コレクティブ・ボリウム(ジョン・ウイリー・アンド・サンズ・インク・ニューヨーク)[Organic Syntheses Collective Volume (John Wiley and Sons, Inc., New York)]第4巻、461頁(1963年)、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサエティ、パーキン・トランサクションズ・1[Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1]2483頁(1976年)等に記載されている方法またはそれらに準じる方法により製造できる。

- 10 反応図式2の原料化合物である化合物(IV-a-1)、(IV-b-1)またはそれらの塩は以下の反応図式3に従って製造することができる。なお下記に示す化合物(VI-a-1)、(VI-b-1)、(VI-b-1')及び(VII)の塩としては上記した化合物(1)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式3

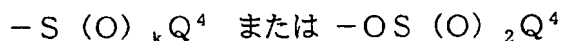


15

[式中、 $\text{L}^{\text{3}}$ は脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$\text{L}^{\text{3}}$ で示される脱離基としては例えば、ハロゲン原子(例えばフッ素、塩素、

臭素、ヨウ素等)、式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される基(例えば、メチルスルホニル  
オキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ、  
5 ベンゼンスルホニルオキシ等)等が用いられる。なかでもハロゲン原子、例えば  
塩素、臭素、ヨウ素が好ましい。

本反応においては化合物(VII)またはその塩を通常1モル当量以上(好まし  
くは1~10モル当量)の化合物(VI-a-1)、(VI-b-1)、(VI-b-1')または  
それらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことが  
10 でき、適当な溶媒としては例えば、アセトニトリル等のニトリル類、アセトン、  
メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMA、  
DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応のうち化合物(VI-a-1)、(VI-b-1)またはそれらの塩を用いる反応は  
一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式1で  
15 示される反応と同様の有機塩基類、無機塩基類、金属アルコキシド類等が用いら  
れる。塩基は化合物(VII)に対して通常1~5モル当量用いられる。また反応を  
加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物または18-  
クラウン-6、15-クラウン-5等の相間移動触媒を添加してもよい。ここで  
用いられるヨウ化物または相間移動触媒は化合物(VII)に対して通常触媒量~1  
20 モル当量程度用いられる。

本反応のうち化合物(VI-b-1')またはその塩を用いる反応においては反応を  
加速させるためにピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等のピリジン化合物を  
添加することができる。ここで用いられるピリジン化合物の量は化合物(VII)に  
25 対して通常触媒量~1モル当量程度である。また化合物(VI-b-1')が液体の場  
合には本反応を溶媒を用いずに行うことが好適である。

本反応の反応温度は通常約0~150℃、好ましくは約10~100℃である。  
本反応は30分~数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液  
体クロマトグラフィ等により確認できる。

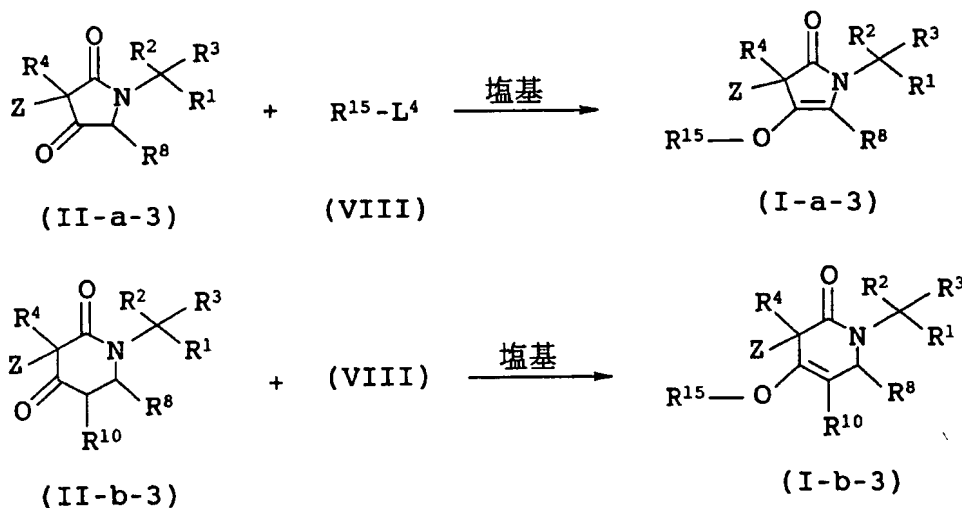
反応図式3の原料化合物である化合物(VII)またはその塩は公知の化合物で

あるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・ソサエティ [Journal of the American Chemical Society] 第 71 巻、3929 頁 (1949 年)、ヘミッシェ・ベリヒテ [Chemische Berichte] 第 106 巻、1083 頁 (1973 年)、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [the Journal of Organic Chemistry] 第 46 巻、2082 頁 (1981 年)、同第 57 巻、4521 頁 (1992 年)、特開昭 60-115552 号公報等に記載されている方法またはそれらに準じる方法により製造できる。

反応図式 3 の原料化合物である化合物 (VI-a-1)、(VI-b-1)、(VI-b-1') またはそれらの塩は例えば、 $\alpha$ -ハロケトン (あるいはアルデヒド) 化合物 (例、クロロアセトン等)、 $\beta$ -ハロケトン (あるいはアルデヒド) 化合物 (例、 $\beta$ -クロロプロピオフェノン等) または  $\alpha, \beta$ -不飽和ケトン (あるいはアルデヒド) 化合物 (例、メチルビニルケトン等) である。これらは公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物 (I) またはその塩のうち、化合物 (I-a-3)、(I-b-3) またはそれらの塩は以下の反応図式 4 に従って製造できる。なお下記に示す化合物 (VIII) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 4



[式中、L<sup>4</sup>は脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

L<sup>4</sup>で示される脱離基としては例えば、ハロゲン原子（例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等）または式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される基（例えば、メチルスルホニル

5 オキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ、メトキシスルホニルオキシ等）等が用いられる。なかでも塩素、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ等が好ましい。

本反応においては化合物（II-a-3）、（II-b-3）またはそれらの塩を通常1モル当量以上（好ましくは1～2モル当量）の化合物（VIII）またはその塩と反応  
10 させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、アセトニトリル等のニトリル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、DMF、DMA、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

15 本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式1で示される反応と同様の有機塩基類、無機塩基類、金属アルコキシド類等が用いられる。これらの塩基は化合物（II-a-3）または（II-b-3）に対して通常1～5モル当量用いられる。

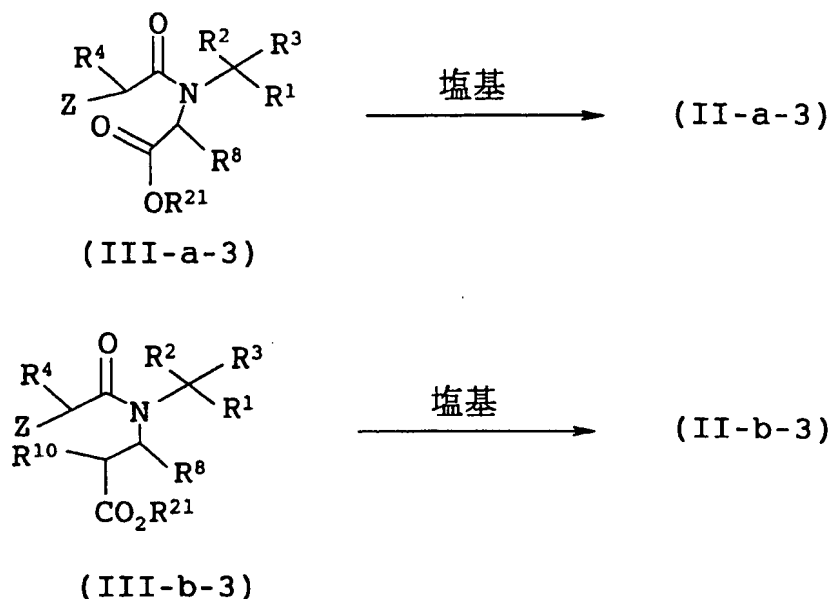
本反応の反応温度は通常約0～150℃、好ましくは約10～100℃である。  
20 本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式4の原料化合物である化合物（VIII）またはその塩は通常ハロゲン化合物（例、クロロメチルメチルエーテル等）、スルホン酸エステル化合物（例、p-トルエンスルホン酸メチル等）、硫酸エステル化合物（例、ジメチル硫酸等）  
25 等であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

反応図式4の原料化合物である化合物（II-a-3）、（II-b-3）またはそれらの塩は以下の反応図式5に従って製造できる。なお下記に示す化合物（III-a-3）及び（III-b-3）の塩としては上記した化合物（I）の塩と同様のものが用いら

れる。

反応図式 5



[式中、 $\text{R}^{21}$ は $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

- 5       $\text{R}^{21}$ で示される $\text{C}_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル、イソプロピル等があげられる。

- 本反応においては化合物 (III-a-3)、(III-b-3) またはそれらの塩を塩基と反応させて分子内クライゼン縮合反応を行う。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、メタノール、エタノール、
- 10      イソプロピルアルコール等のアルコール類、THF、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

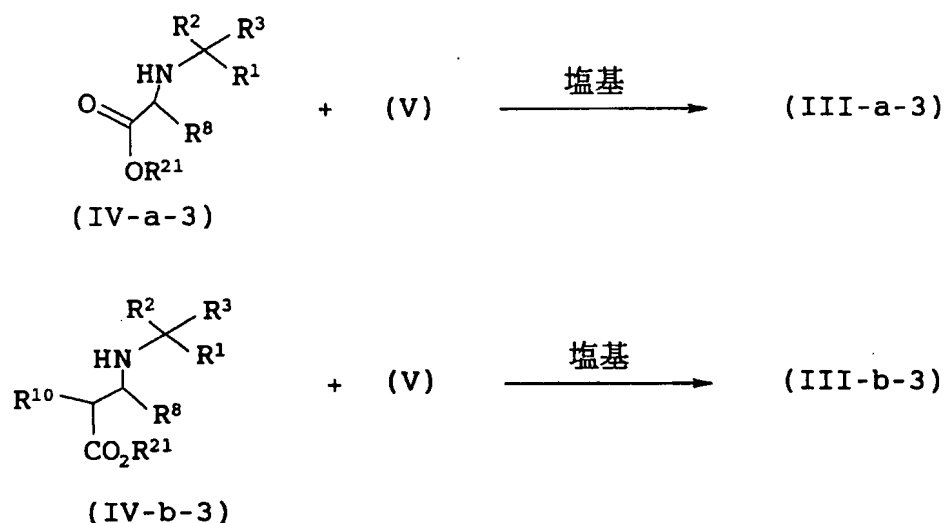
- 本反応に用いられる塩基としては例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウム
- 15      エトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド類、水素化ナトリウム等の無機塩基類等が用いられる。塩基の使用量は化合物 (III-a-3) または (III-b-3) 1モルに対して触媒量～5モル程度である。

本反応の反応温度は通常約 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは約 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ である。本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、

高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

- 反応図式 5 の原料化合物である化合物 (III-a-3)、(III-b-3) またはそれらの塩は新規な化合物であり、これらは以下の反応図式 6 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (IV-a-3) 及び (IV-b-3) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 6



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 本反応においては化合物 (IV-a-3)、(IV-b-3) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1 ～ 2 モル当量）の化合物 (V) またはその塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 2 に示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の溶媒が用いられる。

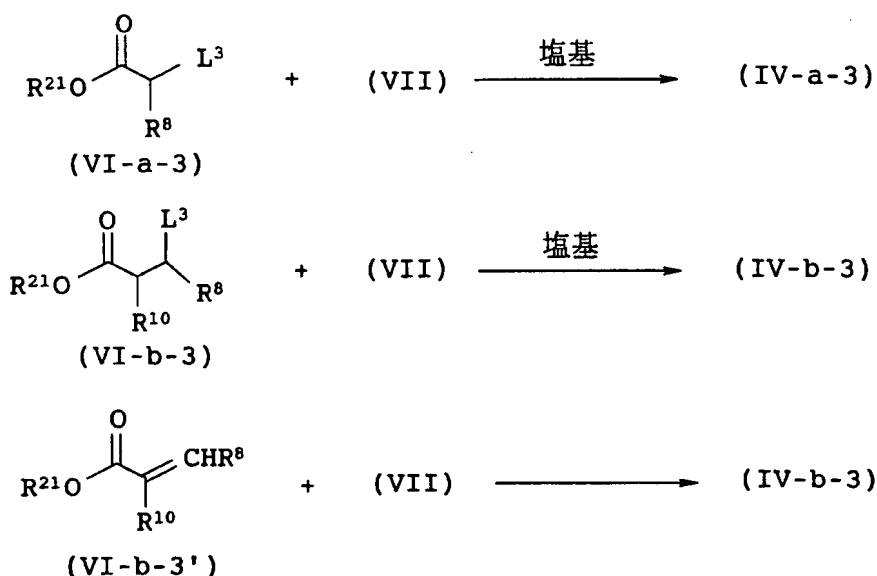
- 本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 2 に示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量は化合物 (IV-a-3) または (IV-b-3) に対して通常 1 モル当量以上（好ましくは 1 ～ 2 モル当量）である。

本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 2 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様である。

- 反応図式 6 の原料化合物である化合物 (IV-a-3)、(IV-b-3) またはそれらの

塩は以下の反応図式 7 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (VI-a-3)、(VI-b-3) 及び (VI-b-3') の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 7



5

[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (VII) またはその塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1 ～ 10 モル当量）の化合物 (VI-a-3)、(VI-b-3)、(VI-b-3') またはそれらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 3 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

10

本反応のうち化合物 (VI-a-3)、(VI-b-3) またはそれらの塩を用いる反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 3 で示される反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量は化合物 (VII) に対して通常 1 ～ 5 モル当量である。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物は化合物 (VII) に対して通常触媒量～ 1 モル当量程度用いられる。

15

本反応のうち化合物 (VI-b-3') またはその塩を用いる反応においては反応を加速させるためにピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等のピリジン化合物を添加することができる。ここで用いられるピリジン化合物の量は化合物 (VII) に



対して通常触媒量～1モル当量程度である。また化合物(VI-b-3')が液体の場合には本反応を溶媒を用いずに行うことが好適である。また本反応を更に加速するためには封管中で加圧下に反応を行うことも可能である。

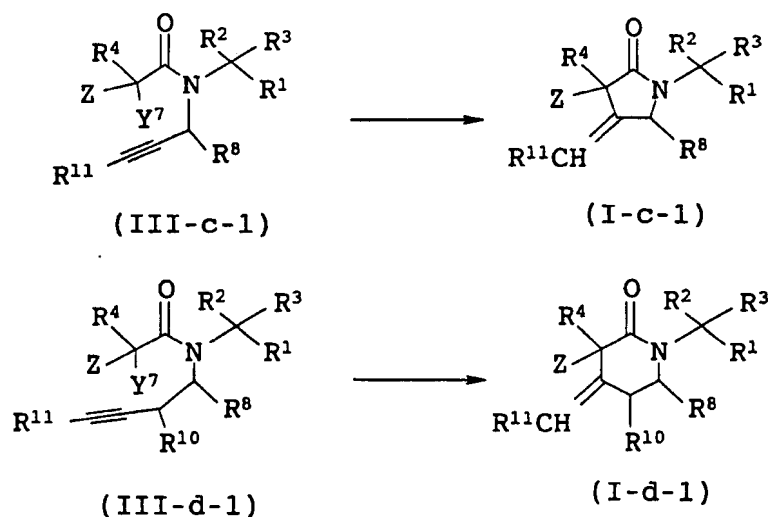
本反応の反応温度は通常約0～200℃、好ましくは約20～170℃である。

- 5 本反応は30分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式7の原料化合物である化合物(VI-a-3)、(VI-b-3)、(VI-b-3')またはそれらの塩は例えば、 $\alpha$ -ハロカルボン酸エステル化合物(例、プロモ酢酸エチル等)、 $\beta$ -ハロカルボン酸エステル化合物(例、3-クロロプロピオン酸エチル等)または $\alpha$ 、 $\beta$ -不飽和カルボン酸エステル化合物(例、アクリル酸メチル等)である。これらは公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物(I-c)、(I-d)またはそれらの塩のうち基 $R^{12}$ が水素原子を示す化合物(I-c-1)、(I-d-1)またはそれらの塩は以下の反応図式8に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物(III-c-1)及び(III-d-1)の塩としては上記した化合物(I)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式8



[式中、 $Y^7$ はハロゲン原子を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

- 20  $Y^7$ で示されるハロゲン原子としては例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等

が用いられ、特に臭素及び塩素が好適である。

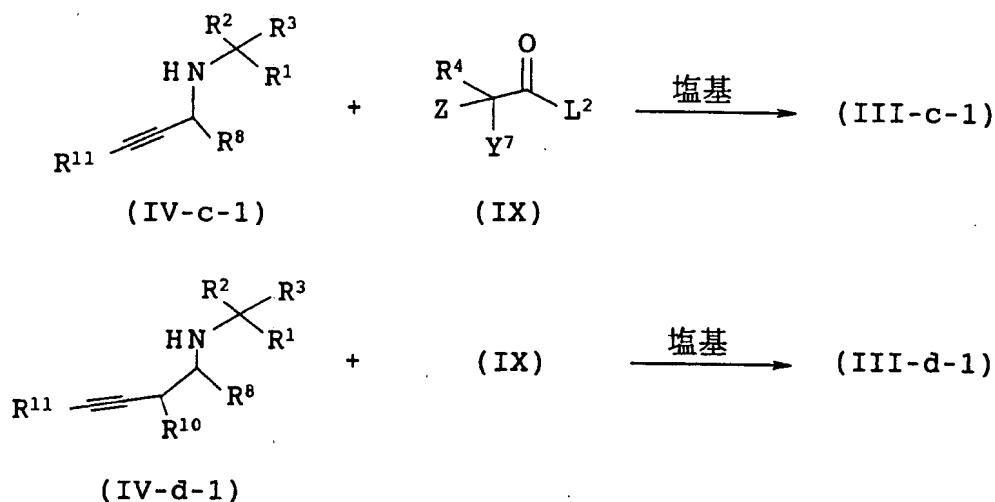
本反応においては化合物 (III-c-1)、(III-d-1) またはそれらの塩をラジカル開始剤の存在下に水素化トリブチルスズ等のラジカル水素化剤と反応させて閉環反応を行う。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類等が用いられる。

本反応に用いられるラジカル開始剤としては例えば、2, 2'-アゾビスイソブチロニトリル (以下、AIBNと略記する)、過酸化ベンゾイル、トリエチルボラン等が用いられる。これらのラジカル開始剤の使用量は化合物 (III-c-1) または (III-d-1) 1 モルに対して通常触媒量用いられる。ラジカル水素化剤の使用量は化合物 (III-c-1) または (III-d-1) に対して通常 1 ~ 5 モル当量である。

本反応の反応温度は通常約 0 ~ 150℃、好ましくは約 50 ~ 100℃である。本反応は 30 分 ~ 30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 8 の原料化合物である化合物 (III-c-1)、(III-d-1) またはそれらの塩は新規な化合物であり、これらは以下の反応図式 9 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (IX)、(IV-c-1) 及び (IV-d-1) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

20      反応図式 9



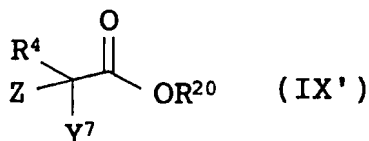
[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (IV-c-1)、(IV-d-1) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1～2 モル当量）の化合物 (IX) またはその塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 2 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の溶媒が用いられる。

本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 2 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の塩基が用いられる。これらの塩基の使用量としては化合物 (IV-c-1) または (IV-d-1) に対して通常 1 モル当量以上（好ましくは 1～2 モル当量）である。

本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 2 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様である。

反応図式 9 の原料化合物である化合物 (IX) またはその塩は一般式



[式中の記号は前記と同意義を示す。]で表される化合物、または化合物 (V) から公知の方法またはそれに準じる方法により容易に製造することができる。また化合物 (IX') は例えば、化合物 (V') から公知の方法またはそれに準じる方法に

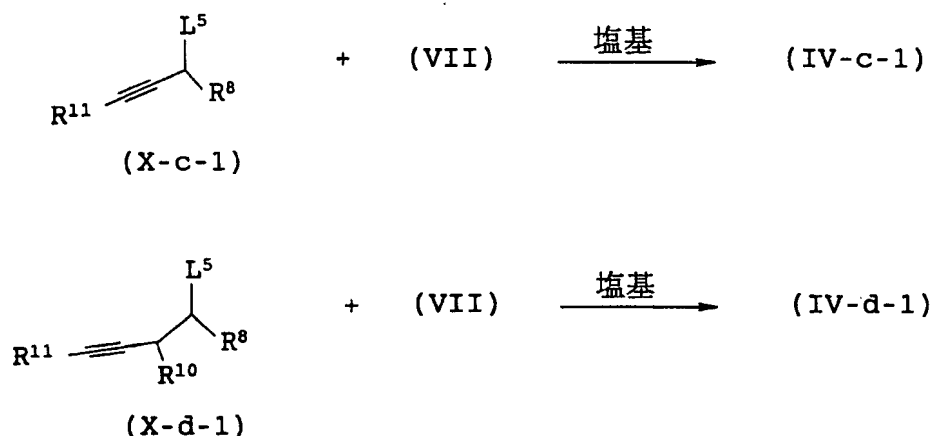
より容易に製造することができる。

反応図式 9 の原料化合物である化合物 (IV-c-1)、(IV-d-1) またはそれらの塩は以下の反応図式 10 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (X-c-1) 及び (X-d-1) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが

5

用いられる。

反応図式 10



[式中、 $\text{L}^5$ は脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$\text{L}^5$ で示される脱離基としては反応図式 3 で示される脱離基  $\text{L}^3$  と同様のものが

10

用いられる。なかでもハロゲン原子、例えば塩素、臭素、ヨウ素が好ましい。

本反応においては化合物 (VII) またはその塩を通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 3 モル当量) の化合物 (X-c-1)、(X-d-1) またはそれらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 3 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

15

本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 3 で示される反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量は化合物 (VII) に対して通常 1 ~ 5 モル当量である。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物は化合物 (VII) に対して通常触媒量 ~ 1 モル当量程度用いられる。

20

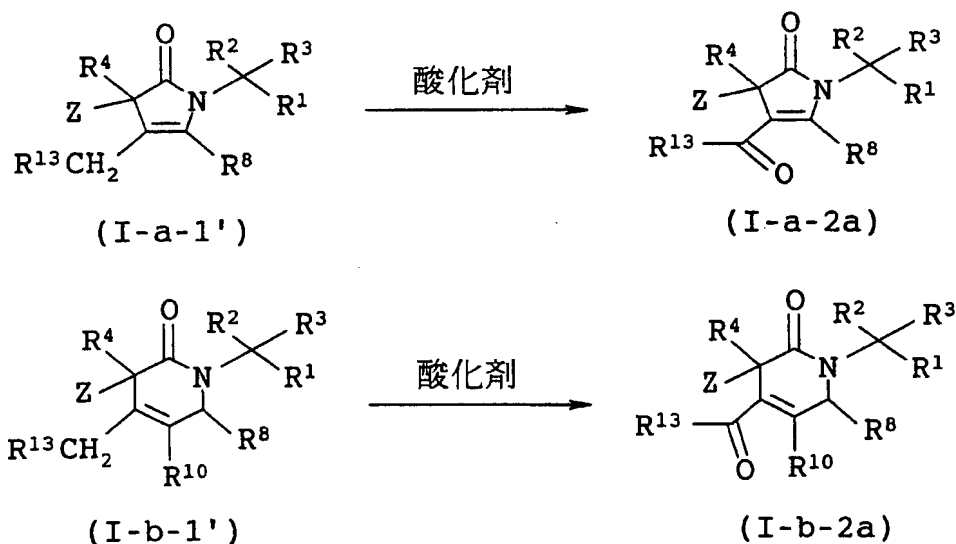
本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 3 で示される反応と同様である。

反応図式 10 の原料化合物である化合物 (X-c-1)、(X-d-1) またはそれらの塩は通常ハロアルキン化合物 (例、臭化プロパルギル等) 等であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物 (I-a-2) または (I-b-2) は各々化合物 (I-a) または (I-b) において基  $R^9$  が基  $R^{9a}$  を示す場合、即ち置換されていてもよいアシル基を示す場合に該当する。このような化合物 (I-a-2) および (I-b-2) は反応図式 1 で得られる化合物 (I-a-1) 及び (I-b-1) を各々酸化剤と反応させることにより得られる。酸化剤としては例えば、二酸化セレン、酸化クロム、酸化クロム-ピリジン錯体等が用いられる。これらの酸化剤は化合物 (I-a-1) または (I-b-1) に対して通常 10 1 ~ 10 モル当量用いられる。

上記化合物 (I-a-2)、(I-b-2) またはそれらの塩のうち特に基  $R^{9a}$  として式  $R^{13}CO-$  (式中、 $R^{13}$  は水素原子、またはそれぞれハロゲンで 1 ~ 3 個置換されていてよい (i)  $C_{1-6}$  アルキル基、(ii)  $C_{6-14}$  アリール基もしくは (iii)  $C_{7-19}$  アラルキル基を示す。) で表される基を示す化合物 (I-a-2a)、  
15 (I-b-2a) またはそれらの塩は以下の反応図式 11 に従って製造することができる。

反応図式 11



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

$R^{13}$ で示されるハロゲン（例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等）で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル、イソプロピル、トリフルオロメチル等があげられ、ハロゲン（例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等）で1～3個置換されていてもよい $C_{6-14}$ アリール基としては例えば、フェニル、ナフチル、4-クロロフェニル等があげられ、ハロゲン（例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等）で1～3個置換されていてもよい $C_{7-19}$ アラルキル基としては例えば、ベンジル、4-クロロベンジル等があげられる。

本反応においては化合物(I-a-1)のうち基 $R^{9p}$ が基 $R^{13}CH_2$ に該当する化合物である化合物(I-a-1')もしくはその塩、または化合物(I-b-1)のうち基 $R^{9p}$ が基 $R^{13}CH_2$ に該当する化合物である化合物(I-b-1')もしくはその塩を原料化合物とし、これらを酸化剤と反応させて各々化合物(I-a-2a)もしくはその塩、または化合物(I-b-2a)もしくはその塩を製造する。

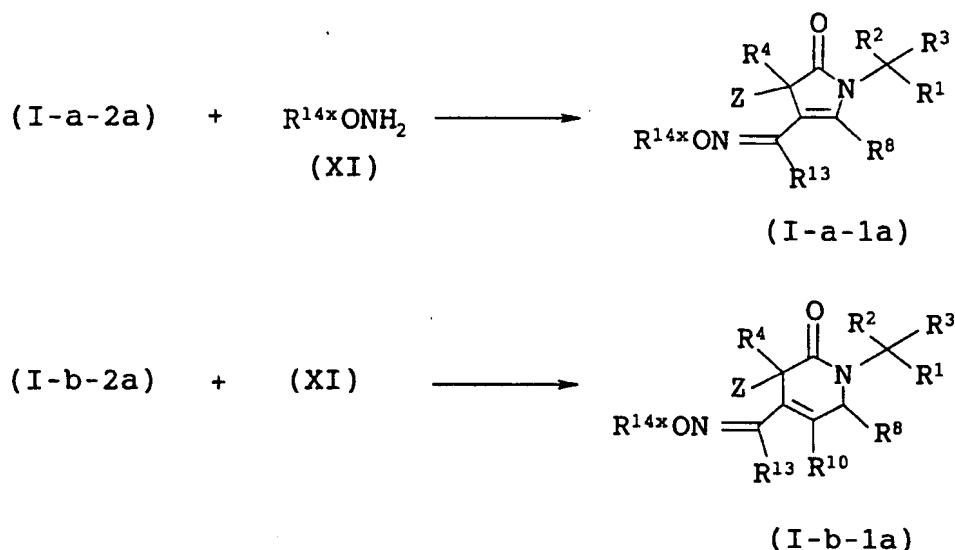
本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、エタノール、tert-ブチルアルコール等のアルコール類、ジオキサン等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、無水酢酸等の酸無水物類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応に用いられる酸化剤としては例えば、二酸化セレン、酸化クロム、酸化クロム-ピリジン錯体等が用いられる。これらの酸化剤は化合物(I-a-1')または(I-b-1')に対して通常1～10モル当量用いられる。

本反応の反応温度は通常約-20～150℃、好ましくは約0～100℃である。本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

本発明の化合物(I-a-1)、(I-b-1)またはそれらの塩のうち基 $R^{9p}$ が式 $-CR^{13}=NOR^{14x}$ （式中、 $R^{14x}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。）で表される基を示す場合に該当する化合物(I-a-1a)、(I-b-1a)またはそれらの塩は以下の反応図式12に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物(XI)の塩としては上記した化合物(I)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 1 2



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

5.  $\text{R}^{14x}$ で示される $\text{C}_{1-6}$ アルキル基としては $\text{R}^{14}$ で示される $\text{C}_{1-6}$ アルキル基と同様のものが用いられ、例えば、メチル、エチル等が用いられる。

本反応においては化合物(I-a-2a)、(I-b-2a)またはそれらの塩を通常1モル当量以上(好ましくは1~3モル当量)の化合物(XI)またはその塩と反応させて化合物(I-a-1a)、(I-b-1a)またはそれらの塩を製造する。

10. 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、DMF、DMA等の非プロトン性極性溶媒類等が用いられる。

本反応の反応温度は通常約 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは約 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ である。本反応は30分~30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

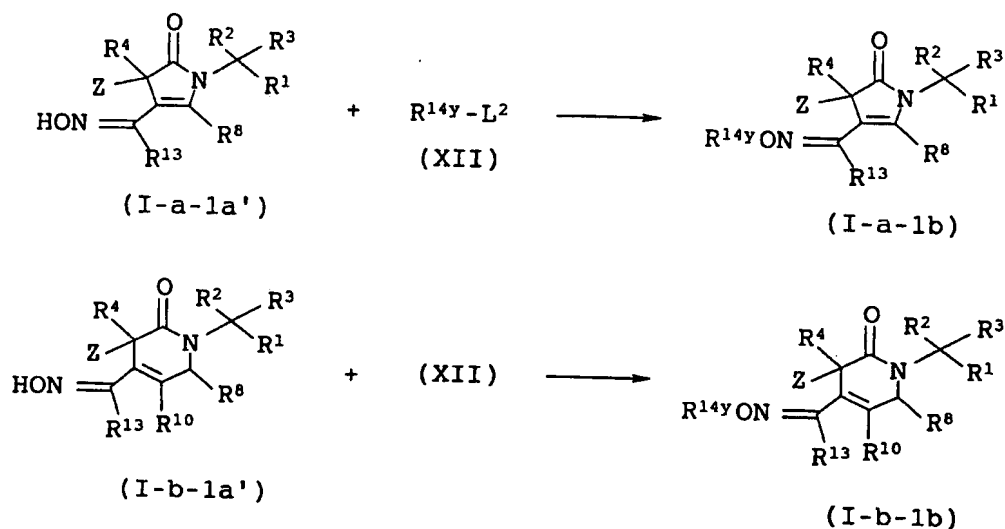
15. 反応図式12の原料化合物である化合物(XI)またはその塩は通常のヒドロキシルアミン、O-アルキルヒドロキシルアミン化合物(例、O-メチルヒドロキシルアミン等)等であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物(I-a-1)、(I-b-1)またはそれらの塩のうち基 $\text{R}^{9p}$ が式

$-\text{CR}^{13}=\text{NOR}^{14y}$  (式中、 $\text{R}^{14y}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。)で表される基を示す場合に該当する化合物 (I-a-1b)、(I-b-1b) またはそれらの塩は以下の反応図式 1 3 に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物

5

反応図式 1 3



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 10  $\text{R}^{14y}$ で示されるハロゲン (例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等) で1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基としては $\text{R}^{14}$ で示されるハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基と同様のものが用いられ、例えば、アセチル、プロピオニル、トリフルオロアセチル等が用いられる。
- 15 本反応においては化合物 (I-a-1a) のうち基 $\text{R}^{14x}$ が水素原子を示す化合物 (I-a-1a') もしくはその塩、または化合物 (I-b-1a) のうち基 $\text{R}^{14x}$ が水素原子を示す化合物 (I-b-1a') もしくはその塩を原料化合物とし、これらを通常1モル当量以上 (好ましくは1～3モル当量) の化合物 (XII) またはその塩と反応させて各々化合物 (I-a-1b) もしくはその塩、または化合物 (I-b-1b) もしくはその塩を製造する。
- 20



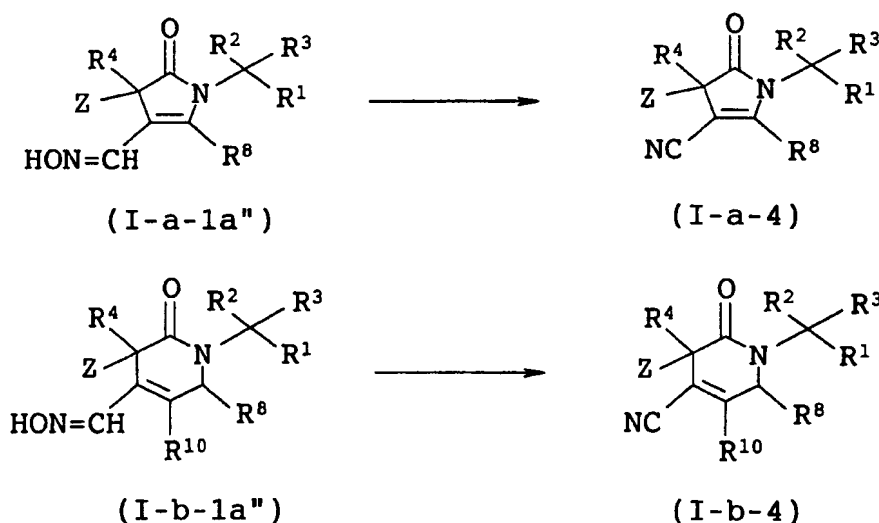
- 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、THF、ジオキサン等のエーテル類、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類等が用いられる。また本反応においては反応を加速させるために塩基を添加することもできる。このような塩基としては例
- 5 えば、ピリジン、トリエチルアミン等があげられる。塩基の使用量は化合物 (I-a-1a') または (I-b-1a') に対して通常 1~5 モル当量である。

本反応の反応温度は通常約 -20~150℃、好ましくは約 0~100℃である。本反応は 30 分~30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

- 10 反応図式 13 の原料化合物である化合物 (XII) またはその塩は通常のカルボン酸ハロゲン化物 (例、塩化アセチル等)、カルボン酸無水物 (例、無水酢酸等) 等であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

- 本発明の化合物 (I-a)、(I-b) またはそれらの塩のうち基 R<sup>9</sup> がシアノ基を示す場合に該当する化合物 (I-a-4)、(I-b-4) またはそれらの塩は以下の反応
- 15 図式 14 に従って製造することができる。

反応図式 14



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

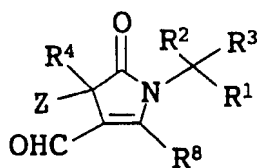
- 20 本反応においては化合物 (I-a-1a) のうち基 R<sup>13</sup> 及び R<sup>14</sup> が共に水素原子を

示す化合物 (I-a-1a'') もしくはその塩、または化合物 (I-b-1a) のうち基  $R^{13}$  及び  $R^{14}$  が共に水素原子を示す化合物 (I-b-1a'') もしくはその塩を脱水反応に付して各々化合物 (I-a-4) もしくはその塩、または化合物 (I-b-4) もしくはその塩を製造する。

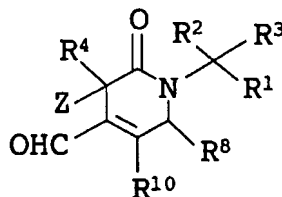
- 5 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、THF、DMF等が用いられる。本反応に用いられる脱水反応剤としては例えば、オキシ塩化リンとDMFから調製されるヴィルスマイヤー[Vilsmeier]反応剤等が用いられる。また本反応においては反応を加速させるために塩基を添加することもできる。このような塩基としては例えば、ピリジン、トリエ
- 10 ルアミン等があげられる。脱水反応剤及び塩基の使用量は化合物 (I-a-1a'') または (I-b-1a'') に対して通常1～5モル当量である。

本反応の反応温度は通常約-20～150℃、好ましくは約0～100℃である。本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

- 15 また化合物 (I-a-4)、(I-b-4) またはそれらの塩は化合物 (I-a-2a) のうち、基  $R^{13}$  が水素原子を示す、下記に示した化合物 (I-a-2a') もしくはその塩、または化合物 (I-b-2a) のうち、基  $R^{13}$  が水素原子を示す、下記に示した化合物 (I-b-2a') もしくはその塩を原料化合物とし、これらを反応図式12に示される反応の条件下でヒドロキシルアミンまたはその塩と反応させて反応混合物中に
- 20 化合物 (I-a-1a'') もしくはその塩、または化合物 (I-b-1a'') もしくはその塩を発生させた後、これを単離することなく反応混合物中に反応図式14で示される反応で用いられる脱水反応剤を加えて反応図式14で示される反応の条件下反応を行うことにより製造することもできる。



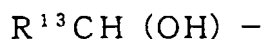
(I-a-2a')



(I-b-2a')

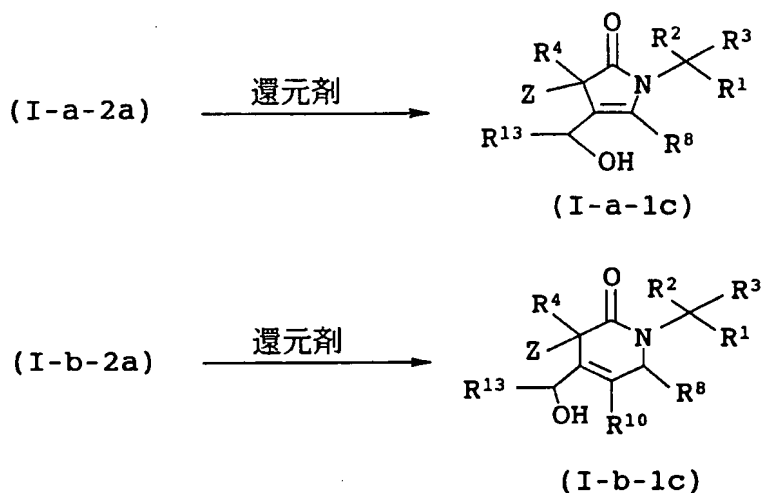
- 25 [式中の記号は前記と同意義を示す。]

本発明の化合物 (I-a-1)、(I-b-1)、またはそれらの塩のうち、基  $R^{9p}$  が式



(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を示す。) で表される基を示す化合物 (I-a-1c)、  
5 (I-b-1c) またはそれらの塩は以下の反応図式 15 に従って製造することもできる。

反応図式 15



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

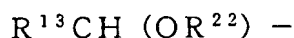
10 本反応においては化合物 (I-a-2a)、(I-b-2a) またはそれらの塩を還元剤と反応させて化合物 (I-a-1c)、(I-b-1c) またはそれらの塩を製造する。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、THF、ジオキサン等のエーテル類、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

15 本反応において用いられる還元剤としては例えば、水素化ホウ素ナトリウム等があげられる。還元剤の使用量は化合物 (I-a-2a) または (I-b-2a) 1 モルに対して通常 1 ~ 5 モル程度である。また還元剤として水素化ホウ素ナトリウムを用いる場合には塩化セリウム (またはその水和物) を添加することが好適である。塩化セリウムの使用量は水素化ホウ素ナトリウム 1 モルに対して通常 1 ~ 3 モル  
20 程度である。

本反応の反応温度は通常約 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ である。本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

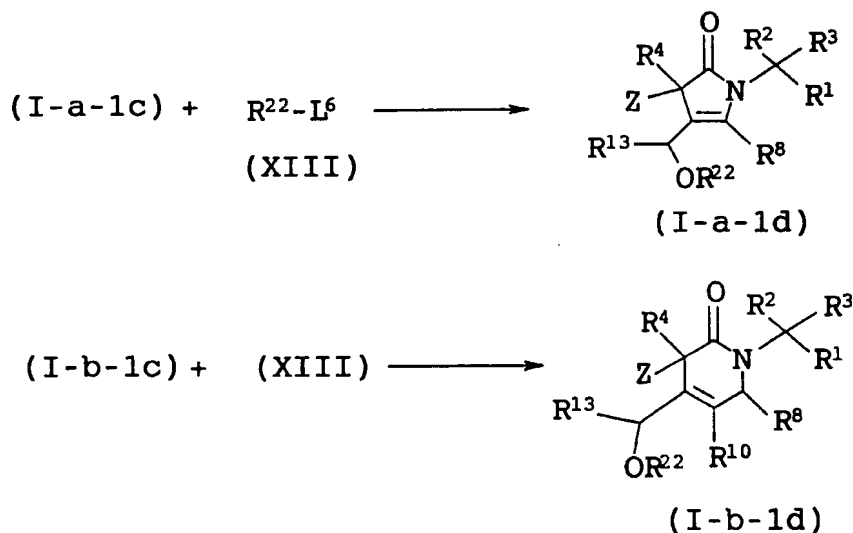
5 本発明の化合物 (I-a-1)、(I-b-1)、またはそれらの塩のうち、基 $R^{9p}$ が式



(式中、 $R^{22}$ はそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基または(ii)  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。)で表される基を示す場合に該当する化合物 (I-a-1d)、(I-b-1d) またはそれらの塩は以下の反応図式16に従って製造することもできる。

10 なお下記に示す化合物 (XIII) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式16



15 [式中、 $L^6$ は脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$R^{22}$ で示されるハロゲン (例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等) で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル等が用いられる。また $R^{22}$ で示されるハロゲン (例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等) で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基としては

例えば、アセチル、プロピオニル、トリフルオロアセチル等が用いられる。

5  $L^6$ で示される脱離基としては反応図式2で示される脱離基 $L^2$ または反応図式3で示される脱離基 $L^3$ と同様のものが用いられる。なかでもハロゲン原子（例えば、塩素、臭素、ヨウ素等）、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基（例えば、アセトキシ基等）等が好ましい。

本反応においては化合物(I-a-1c)、(I-b-1c)またはそれらの塩を通常1モル当量以上の化合物(XIII)またはその塩と反応させて化合物(I-a-1d)、(I-b-1d)またはそれらの塩を製造する。

10 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式2で示される反応のうち第1段階の反応と同様の溶媒が用いられる。

本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては例えば、トリエチルアミン、DBU、ピリジン等の有機塩基類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド類等が用いられる。これらの塩基の使用量としては化合物(I-a-1c)、(I-b-1c)に対して通常1モル当量以上である（好ましくは1～3モル当量）。

20 また化合物(XIII)としてハロゲン化アルキル等を用いる場合には銀塩（例えば、酸化銀等）を添加することによって本反応を加速することができる。銀塩の使用量は化合物(I-a-1c)または(I-b-1c)に対して通常1モル当量以上（好ましくは1～2モル当量）である。

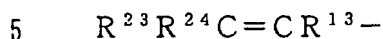
一方、化合物(XIII)としてカルボン酸無水物またはカルボン酸ハロゲン化物等を用いる場合には4-ジメチルアミノピリジン等のアシル化を促進する反応剤を添加することによって本反応を加速することができる。本反応剤の使用量は化合物(I-a-1c)または(I-b-1c)に対して通常触媒量～1モル当量程度である。

25 本反応の反応温度は通常約0～150℃、好ましくは約10～100℃である。本反応は30分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式16の原料化合物である化合物(XIII)またはその塩は例えば、ハロゲン化炭化水素化合物（例、ヨウ化メチル等）、カルボン酸ハロゲン化物（例、

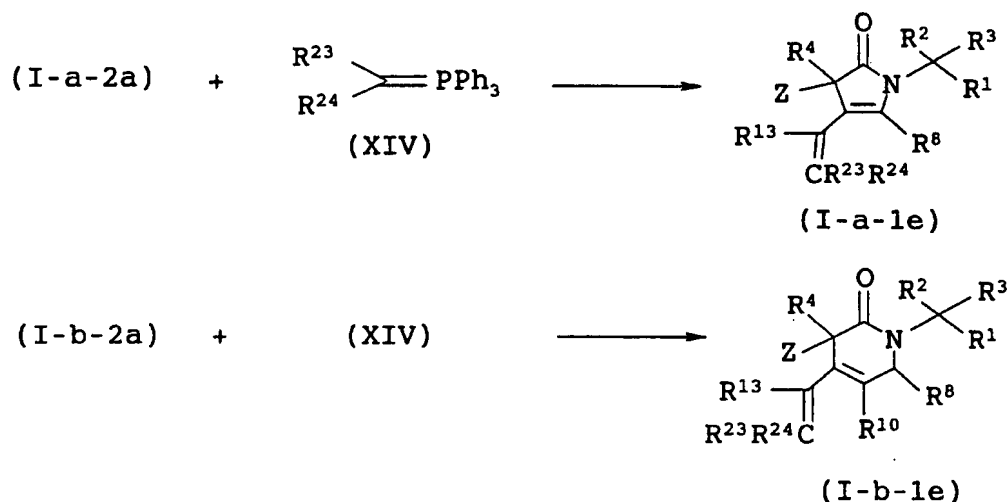
塩化アセチル等)、カルボン酸無水物(例、無水酢酸等)等である。これらは公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物(I-a-1)、(I-b-1)、またはそれらの塩のうち、基 $R^{9p}$ が式



(式中、 $R^{23}$ 及び $R^{24}$ は各々水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、または $C_{1-6}$ アルコキシ基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。)で表される基を示す場合に該当する化合物(I-a-1e)、(I-b-1e)またはそれらの塩は以下の反応図式17に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物(XIV)の塩としては上記した化合物(I)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式17



[式中、Phはフェニル基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

15  $R^{23}$ または $R^{24}$ で示されるハロゲン原子としては例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等が用いられる。 $R^{23}$ または $R^{24}$ で示される $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル等が用いられる。また $R^{23}$ または $R^{24}$ で示される $C_{1-6}$ アルコキシ基としては例えば、メトキシ、エトキシ等が用いられる。

本反応においては化合物(I-a-2a)、(I-b-2a)またはそれらの塩を通常1モル当量以上(好ましくは1~2モル当量)のイリド化合物(XIV)またはその塩

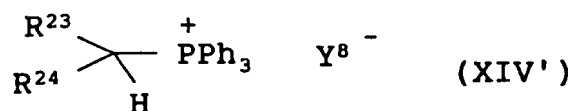
20

と反応させて化合物 (I-a-1e)、(I-b-1e) またはそれらの塩を製造する。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類またはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応の反応温度は通常約 $-80 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 $-70 \sim 50^{\circ}\text{C}$ である。本反応は30分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式17の原料化合物である化合物 (XIV) またはその塩は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、一般式

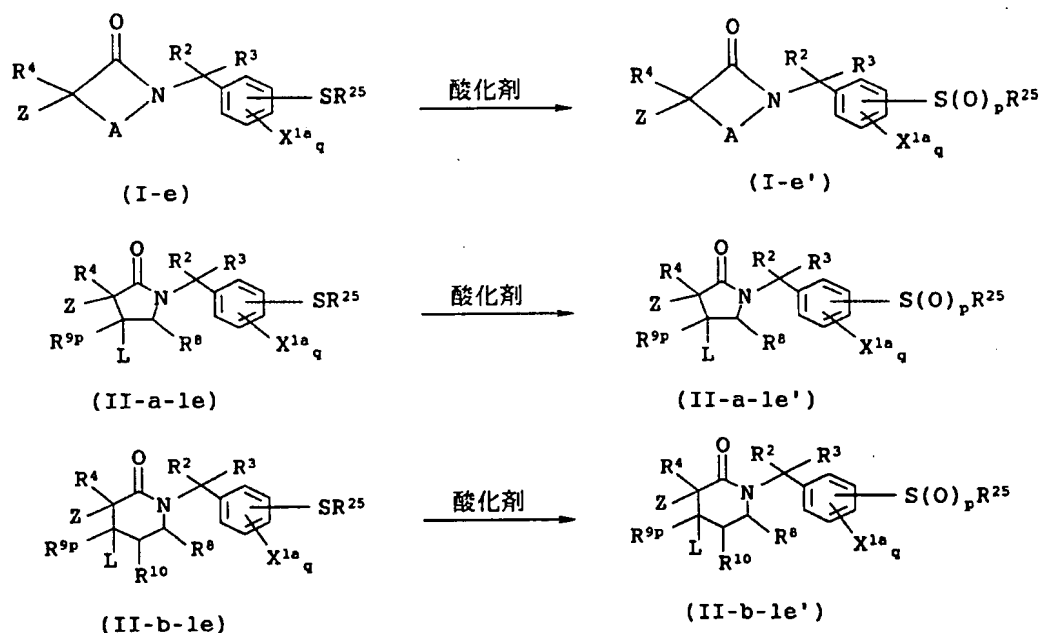


[式中、 $\text{Y}^{\delta}$ はハロゲン原子を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]で表されるホスホニウム塩化合物を通常1モル当量以上の塩基（例えば、水素化ナトリウム等の無機塩基類、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド類、ブチルリチウム、フェニルリチウム等の有機金属化合物類等）と反応させることにより製造することができる。化合物 (XIV) またはその塩を化合物 (XIV') から生成させた後、単離せず、その反応系へ化合物 (I-a-2a)、(I-b-2a) またはそれらの塩を加えることによって反応図式17で示される反応を行うことも可能である。 $\text{Y}^{\delta}$ で示されるハロゲン原子としては例えば、塩素、臭素等が用いられる。化合物 (XIV') は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

本発明の化合物 (I)、(II-a-1)、(II-b-1) またはそれらの塩のうち、基  $\text{R}^1$ が式S (O)<sub>p</sub>R<sup>25</sup> (式中、R<sup>25</sup>はハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基またはフェニル基を示し、pは1または2を示す。) で表される基で置換され、かつ他の置換基  $\text{X}^{1\delta}$  ( $\text{X}^{1\delta}$ は同一または異なってハロゲン原子またはハロゲンで1～3個置換さ

れていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を示す。)で1~2個置換されていてもよいフェニル基を示す場合に該当する化合物(I-e')、(II-a-le')、(II-b-le')またはそれらの塩は以下の反応図式18に従って製造することもできる。

反応図式18



5

[式中、 $q$ は0~2の整数を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$R^{25}$ で示されるハロゲン(例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等)で1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル、イソプロピル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル等があげられる。 $R^{25}$ で示される $C_{2-6}$ アルケニル基としては例えば、アリル等があげられる。 $R^{25}$ で示される $C_{2-6}$ アルキニル基としては例えば、プロパルギル等があげられる。 $X^{1a}$ で示されるハロゲン原子としては例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等が用いられる。 $X^{1a}$ で示されるハロゲン(例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等)で1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル、トリフルオロメチル等があげられる。本反応においては化合物(I)、(II-a-l)、(II-b-l)またはそれらの塩のうち、基 $R^1$ が式 $SR^{25}$ (式中、 $R^{25}$ は前記と同意義を示す。)で表される基で置換され、かつ他の置換基

10

15



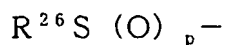
X<sup>1a</sup> (X<sup>1a</sup>は前記と同意義を示す。) で1~2個置換されていてもよいフェニル基を示す化合物 (I-e)、(II-a-le)、(II-b-le) またはそれらの塩を酸化剤等と反応させて酸化し、化合物 (I-e')、(II-a-le')、(II-b-le') またはそれらの塩を製造する。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、  
 5 適当な溶媒としては例えば、水、メタノール、エタノール、1-プロパノール、イソプロピルアルコール、1-ブタノール、tert-ブチルアルコール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、  
 10 トリフルオロ酢酸等のカルボン酸類、DMF等の非プロトン性極性溶媒類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

酸化剤としては例えば、過酸化水素、過マンガン酸カリウム、過酢酸、メタクロロ過安息香酸、過炭酸ナトリウム等が用いられる。本反応に用いる酸化剤の量は反応を完結させるために必要な量を適宜用いればよいが、理論的には化合物 (I-e')、(II-a-le')、(II-b-le') またはそれらの塩のうち p が1を示すものの製造には原料化合物 (I-e)、(II-a-le)、(II-b-le) またはそれらの塩 1  
 15 モルに対して1当量の活性な酸素を発生する量を、また化合物 (I-e')、(II-a-le')、(II-b-le') またはそれらの塩のうち p が2を示すものの製造には原料化合物 (I-e)、(II-a-le)、(II-b-le) またはそれらの塩 1モルに対して2  
 20 当量の活性な酸素を発生する量を用いればよい。

本反応の反応温度は通常約-60~100℃、好ましくは約-20~60℃である。本反応は30分~30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

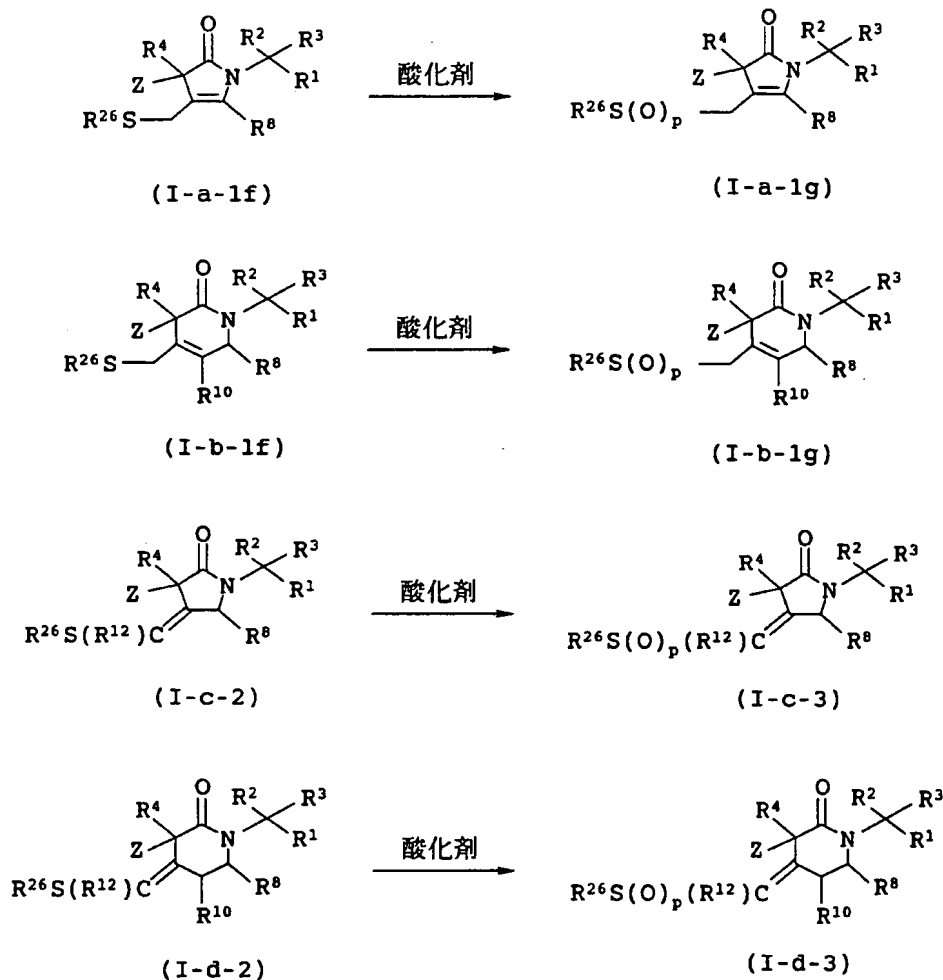
本発明の化合物 (I-a-l)、(I-b-l) またはそれらの塩のうち基 R<sup>9p</sup> が式  
 25  $R^{26}S(O)_pCH_2-$

(式中、R<sup>26</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基を示し、pは前記と同意義を示す。) で表される基を示す場合に該当する化合物 (I-a-lg)、(I-b-lg) またはそれらの塩は以下の反応図式 19 に従って製造することもできる。また本発明の化合物 (I-c)、(I-d) またはそれらの塩のうち基 R<sup>11</sup> が式



(式中の記号は前記と同意義を示す。)で表される基を示す場合に該当する化合物 (I-c-3)、(I-d-3) またはそれらの塩は以下の反応図式 19 に従って製造することもできる。

5 反応図式 19

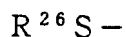


[式中の記号は前記と同意義を示す。]

$R^{26}$ で示される $C_{1-6}$ アルキル基としては例えば、メチル、エチル、イソプロピル等があげられる。

- 10 本反応においては化合物 (I-a-1)、(I-b-1) またはそれらの塩のうち基 $R^9$ が式

$R^{26}SCH_2-$  (式中、 $R^{26}$ は前記と同意義を示す。) で表される基を示す化合物 (I-a-1f)、(I-b-1f) もしくはそれらの塩、または化合物 (I-c)、(I-d) またはそれらの塩のうち基  $R^{11}$  が式



- 5 (式中、 $R^{26}$ は前記と同意義を示す。) で表される基を示す化合物 (I-c-2)、(I-d-2) もしくはそれらの塩を酸化剤等と反応させて酸化し、化合物 (I-a-1g)、(I-b-1g)、(I-c-3)、(I-d-3) またはそれらの塩を製造する。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 18 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

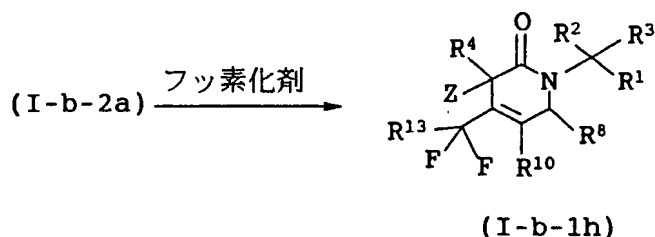
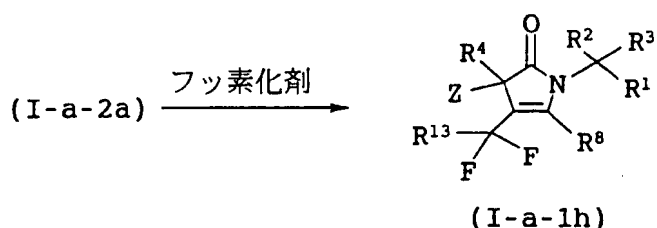
- 10 酸化剤としては反応図式 18 で示される反応と同様の酸化剤が用いられる。本反応に用いる酸化剤の量は反応を完結させるために必要な量を適宜用いればよいが、理論的には化合物 (I-a-1g)、(I-b-1g)、(I-c-3)、(I-d-3) またはそれらの塩のうち  $p$  が 1 を示すものの製造には原料化合物 (I-a-1f)、(I-b-1f)、(I-c-2)、(I-d-2) またはそれらの塩 1 モルに対して 1 当量の活性な酸素を発生する量を、また化合物 (I-a-1g)、(I-b-1g)、(I-c-3)、(I-d-3) またはそれらの塩のうち  $p$  が 2 を示すものの製造には原料化合物 (I-a-1f)、(I-b-1f)、(I-c-2)、(I-d-2) またはそれらの塩 1 モルに対して 2 当量の活性な酸素を発生する量を用いればよい。

- 20 本反応の反応温度は通常約  $-60 \sim 100^\circ\text{C}$ 、好ましくは約  $-20 \sim 60^\circ\text{C}$  である。本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

本発明の化合物 (I-a-1)、(I-b-1) またはそれらの塩のうち基  $R^{9p}$  が式  $R^{13}CF_2-$

- 25 (式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を示す。) で表される基を示す場合に該当する化合物 (I-a-1h)、(I-b-1h) またはそれらの塩は以下の反応図式 20 に従って製造することもできる。

反応図式 20



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

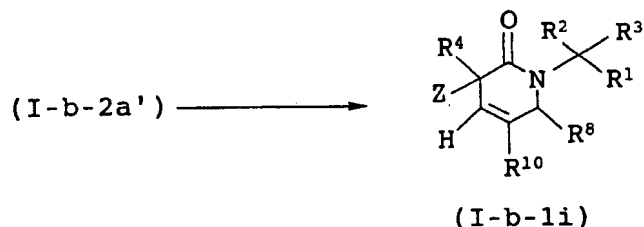
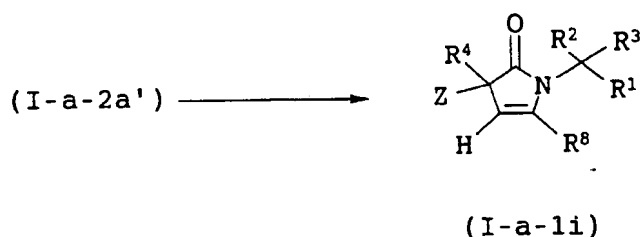
本反応においては化合物 (I-a-2a)、(I-b-2a) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1～5 モル当量）のフッ素化剤と反応させて化合物 (I-a-1h)、(I-b-1h) またはそれらの塩を製造する。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、トリクロロフルオロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジメトキシエタン等のエーテル類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応に用いられるフッ素化剤としては例えば、ジエチルアミノスルファートリフルオリド等があげられる。

本反応の反応温度は通常約 -20～150℃、好ましくは約 0～100℃である。本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

本発明の化合物 (I-a-1)、(I-b-1) またはそれらの塩のうち基 R<sup>9p</sup> が水素原子を示す場合に該当する化合物 (I-a-1i)、(I-b-1i) またはそれらの塩は以下の反応図式 21 に従って製造することもできる。

反応図式 21



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (I-a-2a')、(I-b-2a') またはそれらの塩を通常 1  
 5 モル当量以上（好ましくは 1～2 モル当量）の有機ロジウム錯体と反応させて脱  
 カルボニル化反応を行い、化合物 (I-a-1i)、(I-b-1i) またはそれらの塩を製  
 造する。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒  
 としては例えば、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、  
 ベンゾニトリル等のニトリル類等が用いられる。

本反応に用いられる有機ロジウム錯体としては例えば、クロロトリス（トリフ  
 10 ェニルホスフィン）ロジウム等があげられる。

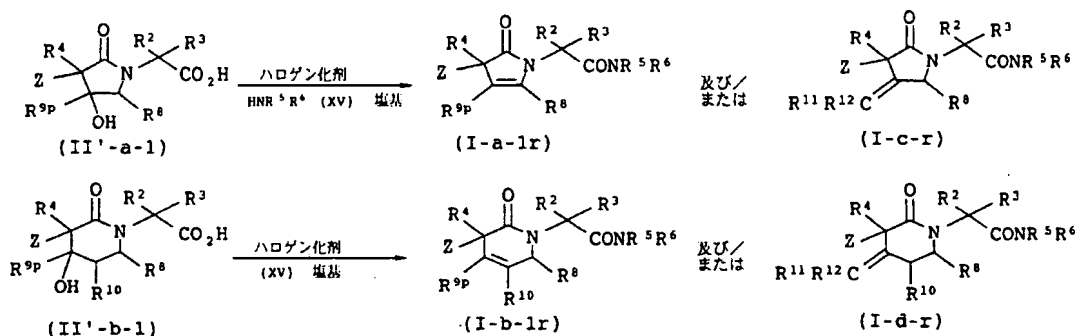
本反応の反応温度は通常約 0～200℃、好ましくは約 50～150℃である。  
 本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高  
 速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

本発明の化合物 (I-a-1)、(I-c)、(I-b-1)、(I-d) またはそれらの塩の  
 15 うち基 R<sup>1</sup> が一般式



（式中の記号は前記と同意義を示す。）で表される基を示す化合物 (I-a-1r)、  
 (I-c-r)、(I-b-1r)、(I-d-r) またはそれらの塩は以下の反応図式 22 に従  
 って製造することもできる。なお下記に示す化合物 (XV) の塩としては上記した  
 20 化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

## 反応図式 2 2



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 本反応においては化合物 (II'-a) のうち基 R<sup>1\*</sup> が水素原子を示す化合物 (II'-a-1) もしくはその塩、または化合物 (II'-b) のうち基 R<sup>1\*</sup> が水素原子を示す化合物 (II'-b-1) もしくはその塩をハロゲン化剤と反応させて基 R<sup>9p</sup> が結合した炭素原子上のヒドロキシ基をハロゲン原子などの脱離性の高い置換基に変換することにより脱離反応させると同時にカルボン酸部分を酸ハロゲン化物に変換し、これを通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 3 モル当量) の化合物 (XV) と反応させることによりアミド形成反応を行う。

- 本反応中の脱離反応については反応図式 1 で示される反応と同様に原料化合物である化合物 (II'-a-1) から基 R<sup>8</sup> が結合した炭素原子上の水素原子及び該ヒドロキシ基が脱離して生成すると考えられる化合物 (I-a-1r) が通常得られるが、基 R<sup>9p</sup> が脱離反応に関与する水素原子を有する場合、即ち基 R<sup>11</sup> R<sup>12</sup> CH に該当する場合にはこの水素原子及び該ヒドロキシ基が脱離して生成する化合物 (I-c-r) も得られることがある。化合物 (II'-b-1) を原料化合物とする場合も同様の理由から化合物 (I-b-1r) が通常得られるが、化合物 (I-d-r) も得られることがある。

- 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、0-ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、THF、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル等のニトリル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エ

チル等のエステル類、DMF、DMA、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

5 本反応に用いられるハロゲン化剤としては例えば、塩化チオニル、トリフェニルホスフィン-四塩化炭素の組み合わせ等の反応剤が用いられる。これらの反応剤の使用量としては化合物(II'-a-1)または(II'-b-1)に対して通常2モル当量以上(好ましくは2~10モル当量)である。またトリフェニルホスフィン-四塩化炭素の組み合わせを用いる場合には四塩化炭素を溶媒の一部として用いることも可能である。

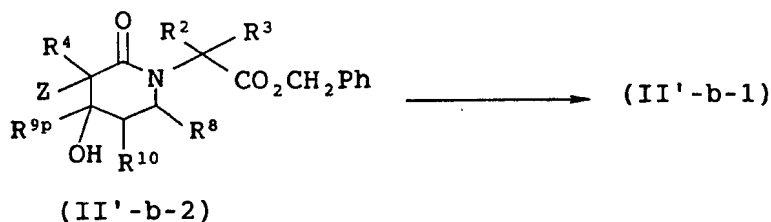
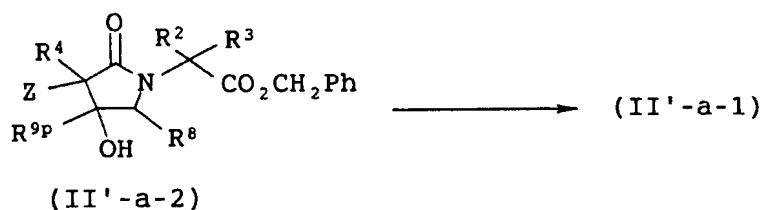
10 本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジン、コリジン、ルチジン、DBU等の有機塩基類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類等が用いられる。塩基は化合物(II'-a-1)または(II'-b-1)に対して通常2~10モル当量用いられる。

15 本反応の反応温度は通常約-20~150℃、好ましくは約0~100℃である。本反応は30分~30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式22の原料化合物である化合物(XV)またはその塩は通常のアミン化合物であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

20 反応図式22の原料化合物である化合物(II'-a-1)、(II'-b-1)またはそれらの塩は以下の反応図式23に従って製造することができる。

反応図式23



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 本反応においては化合物 (II'-a) のうち基  $R^{1*}$  がベンジル基を示す化合物 (II'-a-2) もしくはその塩、または化合物 (II'-b) のうち基  $R^{1*}$  がベンジル基を示す化合物 (II'-b-2) もしくはその塩を接触水素添加反応用の遷移金属触媒の存在下、通常 1 モル当量以上の水素ガスと反応させて水素化分解を行う。

- 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、THF、ジイソプロピルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

本反応に用いられる水素ガスの圧力は 1 ～ 5 気圧程度である。

本反応に用いられる遷移金属触媒としては例えば、パラジウム-活性炭等があげられ、その使用量は化合物 (II'-a-2) または (II'-b-2) に対して触媒量である。

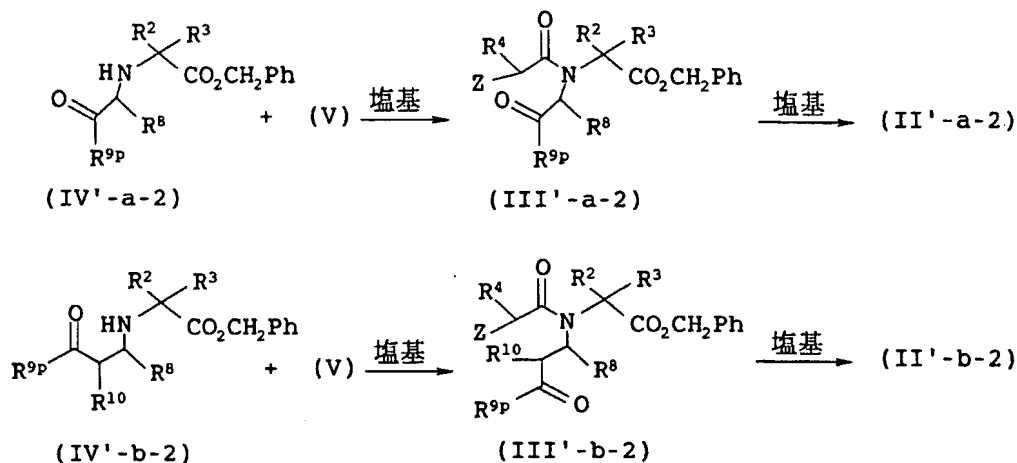
- 本反応の反応温度は通常約 0 ～ 60℃、好ましくは約 10 ～ 30℃である。本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

- 反応図式 23 の原料化合物である化合物 (II'-a-2)、(II'-b-2) またはそれらの塩は以下の反応図式 24 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2)、(IV'-a-2) 及び (IV'-b-2) の塩としては上



記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 2 4



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

- 5      本反応においては第1段階として化合物 (IV'-a-2)、(IV'-b-2) またはそれらの塩を通常1モル当量以上の化合物 (V) またはその塩と反応させて化合物 (II'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩を生成させ、ついで第2段階として化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩を塩基と反応させ、環形成反応を行う。化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩は新規な化合物である。

- 10      本反応は2段階の反応であり、第1段階の、化合物 (IV'-a-2)、(IV'-b-2) またはそれらの塩と化合物 (V) またはその塩との反応で生成する化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩を単離した後、塩基を作用させて環形成反応を行うことが可能である。また第1段階の反応で生成する化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩を単離することなく、その反応混合物中に塩基を添加することにより引き続き第2段階の反応を行うことも可能である。

- 15      本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、第1段階の反応に適当な溶媒としては反応図式2で示される反応のうち第1段階の反応と同様の溶媒が用いられる。また第2段階の反応に適当な溶媒としては第1段階の反応で用いられる溶媒と同様の溶媒が用いられる。

20      第1段階の反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基と

しては反応図式 2 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量としては化合物 (IV'-a-2) または (IV'-b-2) に対して通常 1 モル当量以上である。

5 第 1 段階の反応の反応温度は通常約 -70 ~ 100℃、好ましくは約 -50 ~ 30℃である。本反応は 30 分 ~ 数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

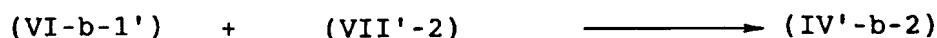
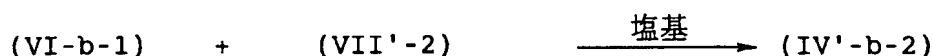
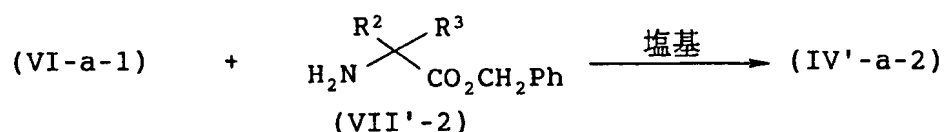
第 2 段階の反応で用いられる塩基としては第 1 段階の反応で用いられる塩基と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量としては化合物 (III'-a-2) または (III'-b-2) に対して通常触媒量 ~ 10 モル当量程度である。また第 1 段階の反応で生成する化合物 (III'-a-2)、(III'-b-2) またはそれらの塩を単離することなく、引き続き第 2 段階の反応を行う場合には第 2 段階の反応に必要な塩基を第 1 段階の反応の開始時に添加しておくことが可能であり、この塩基として第 1 段階で必要とされる塩基と同一のものを使用することもできる。

15 第 2 段階の反応においては反応を加速させるためにルイス酸を添加することもできる。このようなルイス酸としては例えば、四塩化チタン、塩化亜鉛、四塩化スズ、塩化アルミニウム、三フッ化ホウ素・ジエチルエーテル錯体等が用いられる。これらのルイス酸の使用量としては化合物 (III'-a-2) または (III'-b-2) に対して触媒量 ~ 1 モル当量程度である。

20 第 2 段階の反応の反応温度は通常約 -70 ~ 100℃、好ましくは約 -50 ~ 30℃である。本反応は 30 分 ~ 数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 2 4 の原料化合物である化合物 (IV'-a-2)、(IV'-b-2) またはそれらの塩は以下の反応図式 2 5 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (VII'-2) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

25 反応図式 2 5



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (VII'-2) またはその塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1 ～ 10 モル当量）の化合物 (VI-a-1)、(VI-b-1)、(VI-b-1') またはそれらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 3 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

本反応のうち化合物 (VI-a-1)、(VI-b-1) またはそれらの塩を用いる反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 1 で示される反応と同様の有機塩基類、無機塩基類、金属アルコキシド類等が用いられる。塩基は化合物 (VII'-2) に対して通常 1 ～ 5 モル当量用いられる。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物または 18-クラウン-6、15-クラウン-5 等の相間移動触媒を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物または相間移動触媒は化合物 (VII'-2) に対して通常触媒量～1 モル当量程度用いられる。

本反応のうち化合物 (VI-b-1') またはその塩を用いる反応においては反応を加速させるためにピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等のピリジン化合物を添加することができる。ここで用いられるピリジン化合物の量は化合物 (VII'-2) に対して通常触媒量～1 モル当量程度である。また化合物 (VI-b-1') が液体の場合には本反応を溶媒を用いずに行うことが好適である。

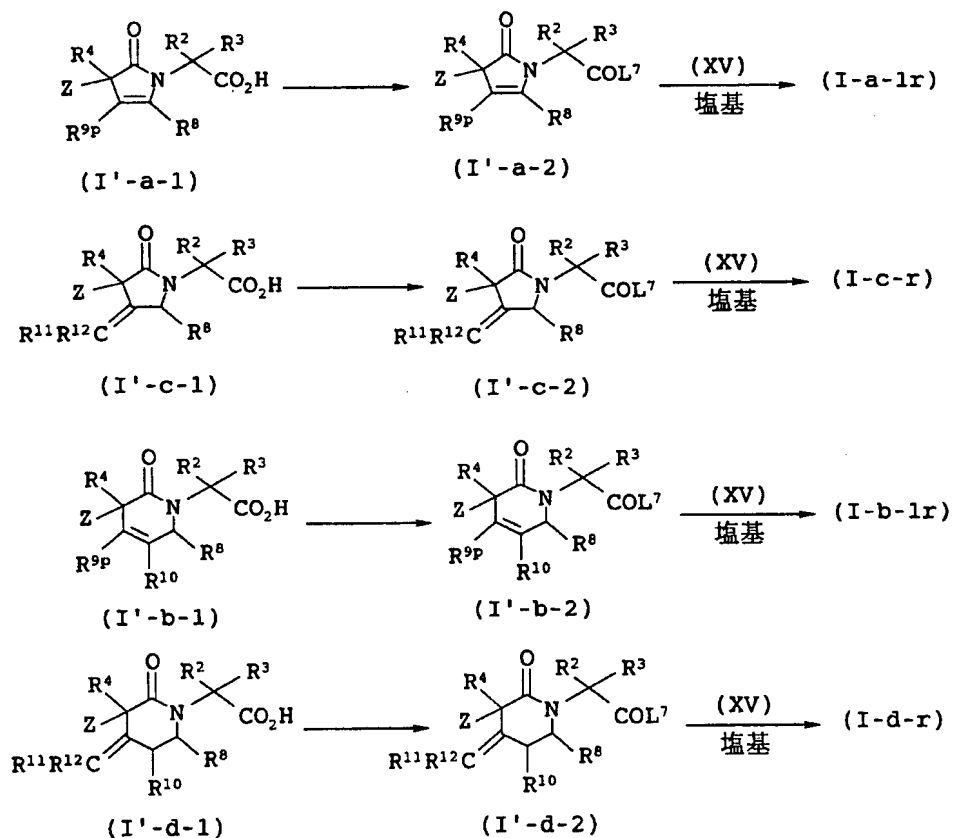
本反応の反応温度は通常約 0 ～ 150℃、好ましくは約 10 ～ 100℃である。本反応は 30 分～数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 25 の原料化合物である化合物 (VII'-2) またはその塩は公知の化合

物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・ソサエティ [Journal of the American Chemical Society] 第 103 巻、6127 頁 (1981 年) 等に記載されている方法またはそれらに準じる方法により製造できる。

- 5 本発明の化合物 (I-a-1r)、(I-c-r)、(I-b-1r)、(I-d-r) またはそれらの塩は以下の反応図式 26 に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物 (I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1)、(I'-d-1)、(I'-a-2)、(I'-c-2)、(I'-b-2) 及び (I'-d-2) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

10 反応図式 26



[式中、L<sup>7</sup>はハロゲン原子を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

L<sup>7</sup>で示されるハロゲン原子としては好ましくは塩素、臭素等が用いられる。

本反応においては第 1 段階として化合物 (I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1)、

(I'-d-1) またはそれらの塩をハロゲン化剤（例、塩化チオニル、トリフェニルホスフィン-四塩化炭素の組み合わせ等の反応剤）と反応させ、各々対応する酸ハロゲン化物である化合物 (I'-a-2)、(I'-c-2)、(I'-b-2)、(I'-d-2) またはそれらの塩とし、ついで第2段階として該酸ハロゲン化物またはその塩を通常1モル当量以上（好ましくは1～3モル当量）の化合物 (XV) またはその塩と反応させる。本反応は2段階反応であり、第1段階の反応で生成する化合物 (I'-a-2)、(I'-c-2)、(I'-b-2)、(I'-d-2) またはそれらの塩を単離した後、これらを化合物 (XV) またはその塩と反応させることが可能である。また第1段階の反応で生成する化合物 (I'-a-2)、(I'-c-2)、(I'-b-2)、(I'-d-2) またはそれらの塩を単離することなく、その反応混合物中に化合物 (XV) またはその塩を添加することにより引き続き第2段階の反応を行うことも可能である。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができる。第1段階の反応で適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類またはこれらの混合溶媒が用いられる。第2段階の反応で適当な溶媒としては例えば、第1段階の反応で用いられる溶媒のほかTHF、ジオキサン等のエーテル類等が用いられる。

第1段階の反応において化合物 (I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1)、(I'-d-1) またはそれらの塩を対応する酸ハロゲン化物またはそれらの塩に変えるための反応剤としては例えば、塩化チオニル、塩化オキサリル、オキシ塩化リン、四塩化炭素-トリフェニルホスフィンの組み合わせ等が用いられる。これらの反応剤は化合物 (I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1) または (I'-d-1) に対して通常1～5モル当量程度用いられる。四塩化炭素-トリフェニルホスフィンの組み合わせを用いる場合には四塩化炭素は反応溶媒の一部として用いることもできる。

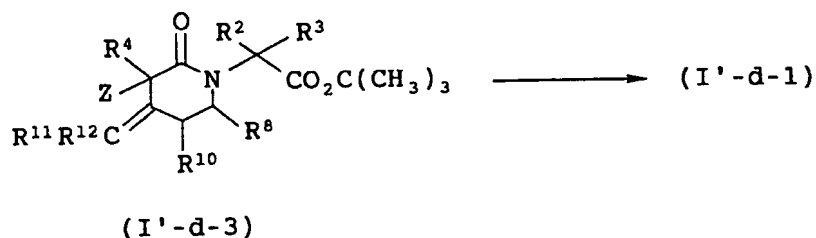
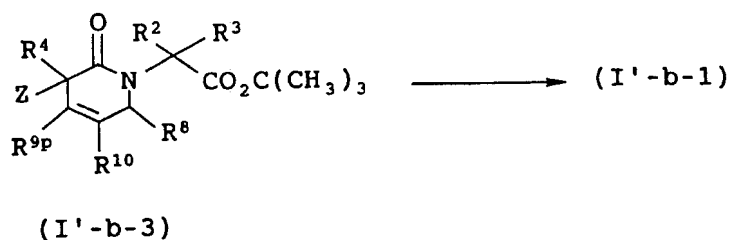
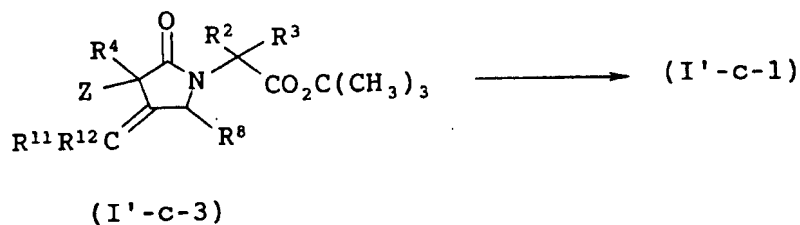
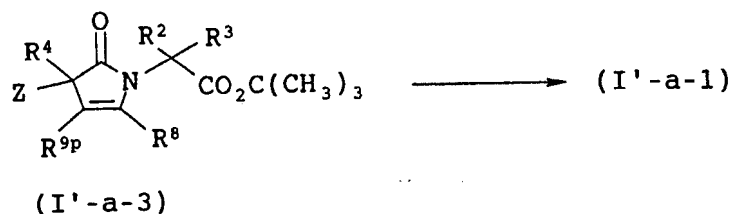
第2段階の反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式22で示される反応と同様な塩基が用いられ、好ましくはピリジン、トリエチルアミン等が用いられる。塩基の使用量は酸ハロゲン化物 (I'-a-2)、(I'-c-2)、(I'-b-2) または (I'-d-2) に対して通常1モル当量以上（好ましくは1～10モル当量）である。

第1段階の反応の反応温度は通常約 $-10 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ である。この反応は30分 $\sim$ 30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

5 第2段階の反応の反応温度は通常約 $-10 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ である。この反応は30分 $\sim$ 数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式26の原料化合物である化合物(I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1)、(I'-d-1)またはそれらの塩は以下の反応図式27に従って製造することができる。なお下記に示す化合物(I'-a-3)、(I'-c-3)、(I'-b-3)及び(I'-d-3)  
10 の塩としては上記した化合物(I)の塩と同様のものが用いられる。

反応図式27



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (I'-a-3)、(I'-c-3)、(I'-b-3)、(I'-d-3) またはそれらの塩を酸と反応させてtert-ブチルエステルからイソブテンを脱離させ、カルボン酸化合物 (I'-a-1)、(I'-c-1)、(I'-b-1)、(I'-d-1) またはそれらの塩を製造する。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類等が用いられる。

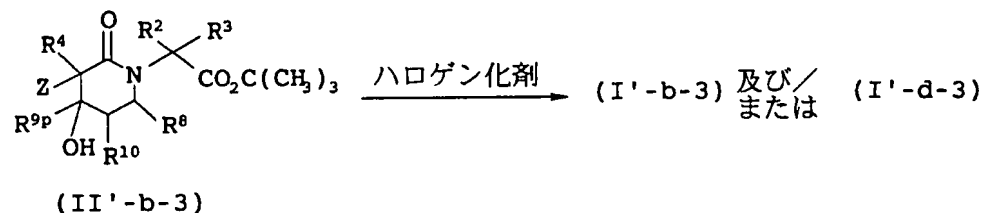
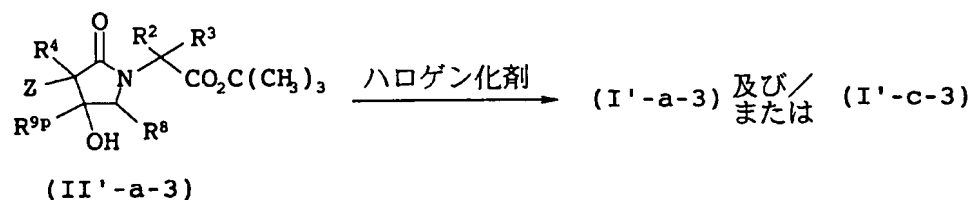
本反応に用いられる酸としては例えば、塩化水素等の無機酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸等があげられる。これらの酸は化合物 (I'-a-3)、(I'-c-3)、(

I'-b-3) 及び (I'-d-3) に対して通常 1 モル当量以上用いられる。またトリフルオロ酢酸等の有機酸を用いる場合はこれを溶媒の一部または全部として用いることも可能である。

5 本反応の反応温度は通常約  $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約  $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$  である。本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 27 の原料化合物である化合物 (I'-a-3)、(I'-c-3)、(I'-b-3)、(I'-d-3) またはそれらの塩は以下の反応図式 28 に従って製造することができる。

10 反応図式 28



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (II'-a) のうち基  $\text{R}^{1*}$  が tert-ブチル基を示す化合物 (II'-a-3) もしくはその塩、または化合物 (II'-b) のうち基  $\text{R}^{1*}$  が tert-ブチル基を示す化合物 (II'-b-3) もしくはその塩をハロゲン化剤と反応させて基  $\text{R}^{9\text{p}}$  が結合した炭素原子上のヒドロキシ基をハロゲン原子などの脱離性の高い置換基に変換することにより脱離反応させる。本脱離反応では反応図式 1 で示される反応と同様に原料化合物である化合物 (II'-a-3) から基  $\text{R}^8$  が結合した炭素原子上の水素原子及び該ヒドロキシ基が脱離して生成すると考えられる化合物 (I'-a-3) が通常得られるが、基  $\text{R}^{9\text{p}}$  が脱離反応に関与する水素原子を有する場合、即ち基  $\text{R}^{11}\text{R}^{12}\text{CH}$  に該当する場合にはこの水素原子及び該ヒドロキシ基

15

20



が脱離して生成する化合物 (I'-c-3) も得られることがある。化合物 (II'-b-3) を原料化合物とする場合も同様の理由から化合物 (I'-b-3) が通常得られるが、化合物 (I'-d-3) も得られることがある。

5 本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 2 2 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

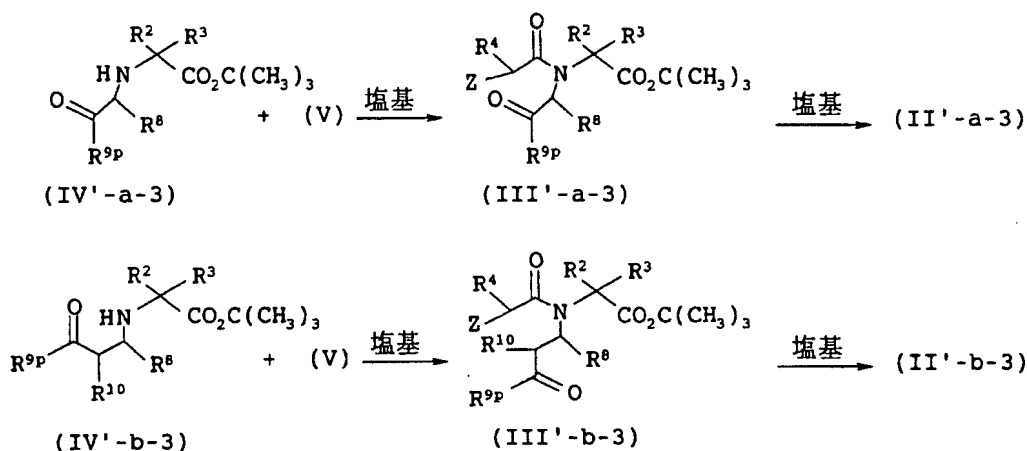
本反応に用いられるハロゲン化剤としては例えば、塩化チオニル、トリフェニルホスフィン-四塩化炭素の組み合わせ等の反応剤が用いられる。これらの反応剤の使用量としては化合物 (II'-a-3) または (II'-b-3) に対して通常 1 モル当量以上（好ましくは 1 ～ 10 モル当量）である。またトリフェニルホスフィン-  
10 四塩化炭素の組み合わせを用いる場合には四塩化炭素を溶媒の一部として用いることも可能である。

本反応においては反応を加速させるために塩基を添加することもできる。このような塩基としては反応図式 2 2 で示される反応と同様の塩基が用いられる。塩基は化合物 (II'-a-3) または (II'-b-3) に対して通常 1 ～ 20 モル当量用い  
15 られる。またピリジン等の有機塩基を溶媒として用いることも可能である。

本反応の反応温度は通常約 -20 ～ 150℃、好ましくは約 0 ～ 100℃である。本反応は 30 分～30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 2 8 の原料化合物である化合物 (II'-a-3)、(II'-b-3) またはそれ  
20 らの塩は以下の反応図式 2 9 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3)、(IV'-a-3) 及び (IV'-b-3) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 2 9



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては第1段階として化合物 (IV'-a-3)、(IV'-b-3) またはそれらの塩を通常1モル当量以上の化合物 (V) またはその塩と反応させて化合物 (II'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩を生成させ、ついで第2段階として化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩を塩基と反応させ、環形成反応を行う。化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩は新規な化合物である。

本反応は2段階の反応であり、第1段階の、化合物 (IV'-a-3)、(IV'-b-3) またはそれらの塩と化合物 (V) またはその塩との反応で生成する化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩を単離した後、塩基を作用させて環形成反応を行うことが可能である。また第1段階の反応で生成する化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩を単離することなく、その反応混合物中に塩基を添加することにより引き続き第2段階の反応を行うことも可能である。

本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、第1段階の反応に適当な溶媒としては反応図式24で示される反応のうち第1段階の反応と同様の溶媒が用いられる。また第2段階の反応に適当な溶媒としては第1段階の反応で用いられる溶媒と同様の溶媒が用いられる。

第1段階の反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式24で示される反応のうち第1段階の反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量としては化合物 (IV'-a-3) または (IV'-b-3) に対して通常

1 モル当量以上である。

第 1 段階の反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 2 4 で示される反応のうち第 1 段階の反応と同様である。

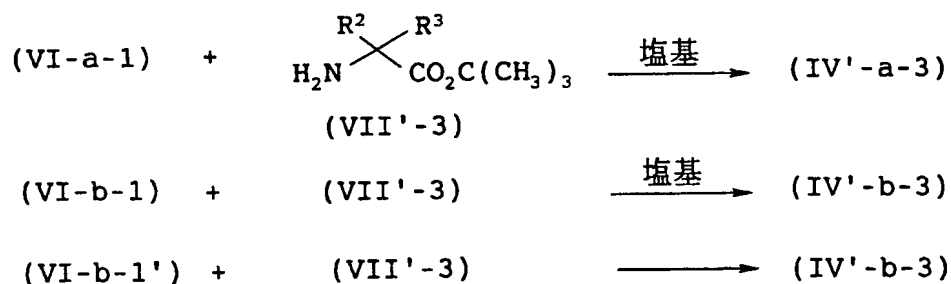
第 2 段階の反応で用いられる塩基としては第 1 段階の反応で用いられる塩基と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量としては化合物 (III'-a-3) または (II I'-b-3) に対して通常触媒量～10 モル当量程度である。また第 1 段階の反応で生成する化合物 (III'-a-3)、(III'-b-3) またはそれらの塩を単離することなく、引き続き第 2 段階の反応を行う場合には第 2 段階の反応に必要な塩基を第 1 段階の反応の開始時に添加しておくことが可能であり、この塩基として第 1 段階  
10 が必要とされる塩基と同一のものを使用することもできる。

第 2 段階の反応においては反応を加速させるためにルイス酸を添加することもできる。このようなルイス酸としては反応図式 2 4 で示される反応のうち第 2 段階の反応と同様なルイス酸が用いられる。これらのルイス酸の使用量としては化合物 (III'-a-3) または (III'-b-3) に対して触媒量～1 モル当量程度である。

第 2 段階の反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 2 4 で示される反応のうち第 2 段階の反応と同様である。  
15

反応図式 2 9 の原料化合物である化合物 (IV'-a-3)、(IV'-b-3) またはそれらの塩は以下の反応図式 3 0 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (VII'-3) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられ  
20 る。

反応図式 3 0



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (VII'-3) またはその塩を通常 1 モル当量以上 (好ま

しくは1～10モル当量)の化合物(VI-a-1)、(VI-b-1)、(VI-b-1')またはそれらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式25で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

5 本反応のうち化合物(VI-a-1)、(VI-b-1)またはそれらの塩を用いる反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式25で示される反応と同様の塩基が用いられる。塩基は化合物(VII'-3)に対して通常1～5モル当量用いられる。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物または18-クラウン-6、15-クラウン-5等の相間移動触媒を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物または相間移動触媒は化合物(VII'-3)に対して通常触媒量～1モル当量程度用いられる。

10 本反応のうち化合物(VI-b-1')またはその塩を用いる反応においては反応を加速させるためにピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等のピリジン化合物を添加することができる。ここで用いられるピリジン化合物の量は化合物(VII'-3)に対して通常触媒量～1モル当量程度である。また化合物(VI-b-1')が液体の場合には本反応を溶媒を用いずに行うことが好適である。

本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式25で示される反応と同様である。

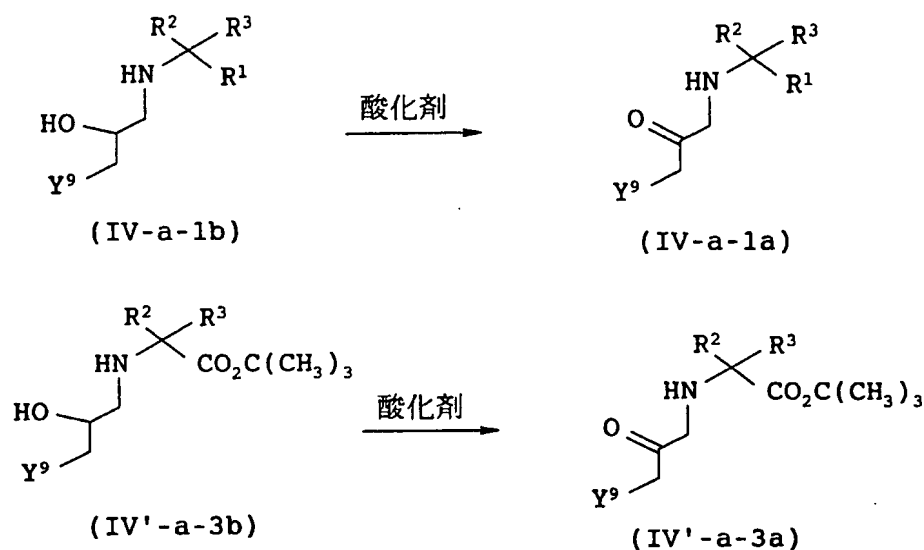
20 反応図式30の原料化合物である化合物(VII'-3)またはその塩は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサエティ[Journal of the Chemical Society] 6227頁(1965年)等に記載されている方法またはそれらに準じる方法により製造できる。

25 反応図式2、29の原料化合物である化合物(IV-a-1)、(IV'-a-3)またはそれらの塩のうち基 $R^8$ が水素原子を示し、基 $R^9$ が式 $Y^9CH_2-$

(式中、 $Y^9$ は $C_{1-6}$ アルコキシ基または $C_{1-6}$ アルキルチオ基を示す。)で表される基を示す場合に該当する化合物(IV-a-1a)、(IV'-a-3a)またはそれらの塩は新規な化合物であり、これらは以下の反応図式31に従って製造することも

できる。なお下記に示す化合物 (IV-a-1b) 及び (IV'-a-3b) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 3 1



5      [式中の記号は前記と同意義を示す。]

Y<sup>9</sup>で示されるC<sub>1-6</sub>アルコキシ基としては例えば、メトキシ、エトキシ等が用いられる。またY<sup>9</sup>で示されるC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基としては例えば、メチルチオ、エチルチオ等が用いられる。

10      本反応においては化合物 (IV-a-1b)、(IV'-a-3b) またはそれらの塩を酸化剤と反応させ、2級アルコール部分をケトンに変換する。

15      本反応に用いられる酸化剤としては例えば、①酸化クロム-硫酸の組み合わせ、酸化クロム-ピリジン錯体、二クロム酸ナトリウム-硫酸の組み合わせ、クロロクロム酸ピリジニウム、二クロム酸ピリジニウム等の通常「クロム酸酸化」と呼ばれる反応に用いられる酸化剤、または②DMSOとその活性化剤（例えば、塩化オキサリル、トリフルオロ酢酸無水物、無水酢酸、塩素ガス等）の組み合わせ等があげられる。

本反応に①の酸化剤を用いる場合には本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、アセトン等のケトン類、ジエチルエ

ーテル等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、ピリジン、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。①の酸化剤の使用量としては化合物 (IV-a-1b) または (IV'-a-3b) に対して通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 10 モル当量) である。

- 5      本反応に①の酸化剤を用いる場合、本反応の反応温度は通常約 -30 ~ 100℃、好ましくは約 0 ~ 50℃である。本反応は 30 分 ~ 30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

- 10      本反応に②の酸化剤を用いる場合には本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類等が用いられる。DMSO の活性化剤として無水酢酸を用いる場合には無水酢酸を溶媒として用いることもできる。また DMSO を溶媒の一部として用いることも可能である。

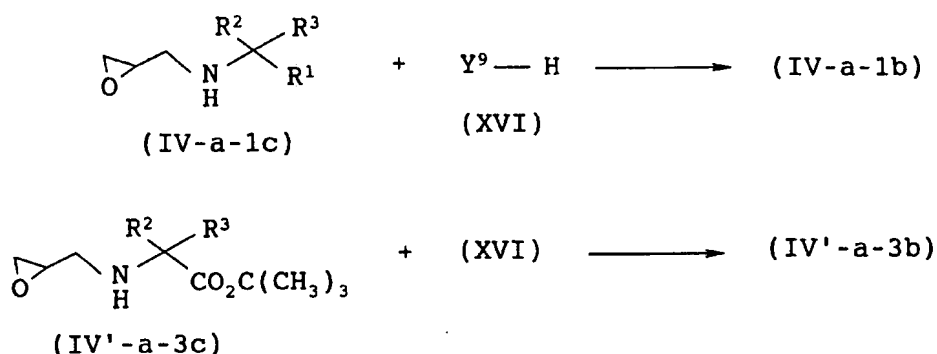
- 15      本反応に②の酸化剤を用いる場合には DMSO の使用量としては化合物 (IV-a-1b) または (IV'-a-3b) に対して通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 10 モル当量) である。また活性化剤の使用量としては化合物 (IV-a-1b) または (IV'-a-3b) に対して通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 10 モル当量) である。

- 20      本反応に②の酸化剤を用いる場合、DMSO の活性化剤として塩化オキサリル、トリフルオロ酢酸無水物または塩素ガスを用いる方法では反応を完結させるために塩基を添加するのが好ましく、このような塩基としてはトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン等の有機塩基類が用いられる。これらの塩基は化合物 (IV-a-1b) または (IV'-a-3b) に対して通常 3 ~ 10 モル当量用いられる。

- 25      本反応に②の酸化剤を用いる場合、本反応の反応温度は通常約 -80 ~ 50℃、好ましくは約 -75 ~ 30℃である。本反応は 30 分 ~ 数日程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 31 の原料化合物である化合物 (IV-a-1b)、(IV'-a-3b) またはそれらの塩は以下の反応図式 32 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (IV-a-1c)、(IV'-a-3c) 及び (XVI) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

## 反応図式 3 2



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

5 本反応においては化合物 (IV-a-1c)、(IV'-a-3c) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 3 モル当量) の化合物 (XVI) またはその塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、THF、ジオキサン等のエーテル類、DMF、DMA、DMSO等の非プロトン性極性溶媒類、水、またはこれらの混合溶媒が用いられる。

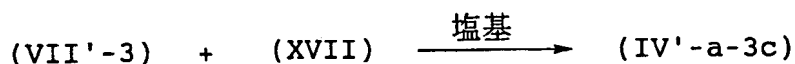
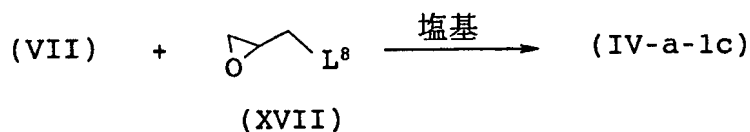
10 本反応に用いられる化合物 (XVI) としては例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン等のメルカプタン類、またはそれらのナトリウム塩、カリウム塩等があげられる。

15 本反応の反応温度は通常約 -20 ~ 150℃、好ましくは約 0 ~ 80℃である。本反応は 30 分 ~ 30 時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 3 2 の原料化合物である化合物 (XVI) またはその塩は通常アルコール類、メルカプタン類等であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

20 反応図式 3 2 の原料化合物である化合物 (IV-a-1c)、(IV'-a-3c) またはそれらの塩は以下の反応図式 3 3 に従って製造することができる。

## 反応図式 3 3



[式中、 $\text{L}^8$ はハロゲン原子を示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

$\text{L}^8$ で示されるハロゲン原子としては例えば、塩素、臭素、ヨウ素等が用いられる。

- 5      本反応においては化合物 (VII)、(VII'-3) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1～3 モル当量）の化合物 (XVII) と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 3 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

- 10      本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 3 で示される反応と同様の塩基が用いられる。これらの塩基の使用量としては化合物 (VII) または (VII'-3) に対して通常 1～5 モル当量である。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物は化合物 (VII) または (VII'-3) に対して通常触媒量～1 モル当量程度用いられる。

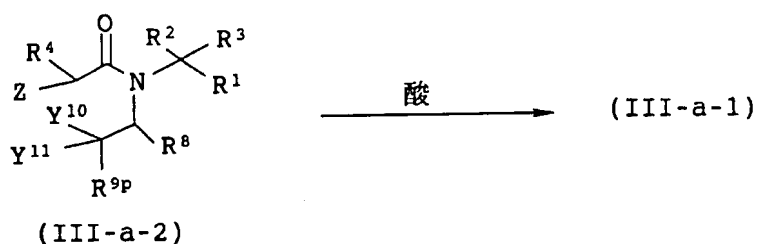
- 15      本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 3 で示される反応と同様である。

反応図式 3 3 の原料化合物である化合物 (XVII) は通常のエピハロヒドリン化合物（例、エピブロモヒドリン等）であり、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

- 20      反応図式 2 で示される化合物 (III-a-1)、(III-b-1) またはそれらの塩は以下の反応図式 3 4 に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物 (III-a-2) 及び (III-b-2) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 3 4





[式中、Y<sup>10</sup>及びY<sup>11</sup>はそれぞれC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を示すか、または一緒になってエチレンジオキシもしくはプロピレンジオキシを示し、他の記号は前記と同意義を示す。]

- 5      Y<sup>10</sup>またはY<sup>11</sup>で示されるC<sub>1-6</sub>アルコキシ基としては例えば、メトキシ、エトキシ等が用いられる。

- 10      本反応においては化合物 (III-a-2)、(III-b-2) またはそれらの塩を酸と反応させ、アセタール部分をカルボニル基に変換する。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、ジエチルエーテル、THF、ジオキサン等のエーテル類、水またはこれらの混合溶媒が用いられる。

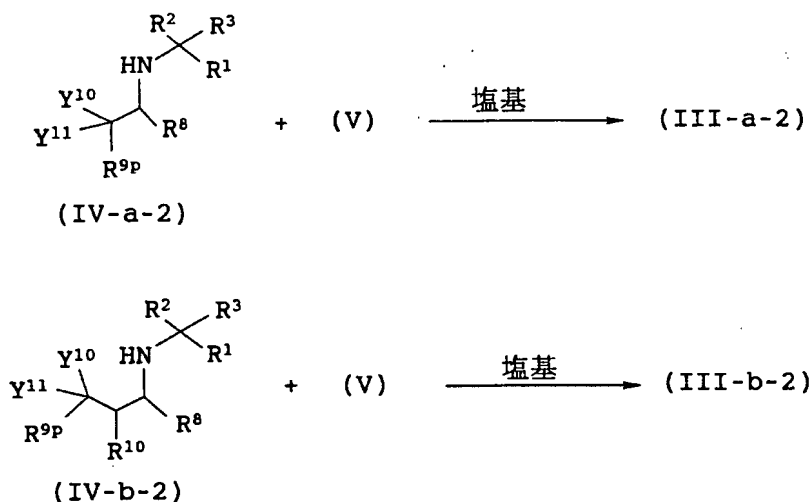
- 15      本反応に用いられる酸としては例えば、p-トルエンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、カンファースルホン酸等の有機酸、塩化水素、臭化水素等の無機酸等があげられる。これらの酸の使用量としては化合物 (III-a-2) または (III-b-2) に対して通常触媒量～1モル当量程度である。

- 20      本反応の反応温度は通常約-20～150℃、好ましくは約0～100℃である。本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、

高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式 3 4 の原料化合物である化合物 (III-a-2)、(III-b-2) またはそれらの塩は新規な化合物であり、これらは以下の反応図式 3 5 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (IV-a-2) 及び (IV-b-2) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 3 5



[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (IV-a-2)、(IV-b-2) またはそれらの塩を通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 2 モル当量) の化合物 (V) またはその塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 2 に示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の溶媒が用いられる。

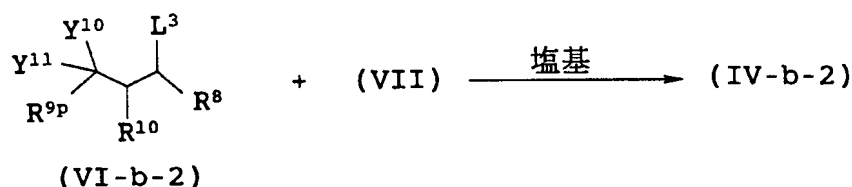
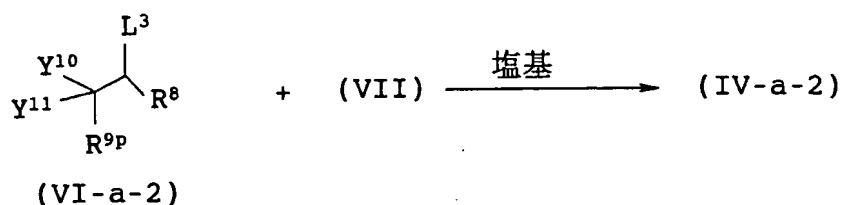
本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 2 に示される反応のうち第 1 段階の反応と同様の塩基が用いられる。塩基の使用量は化合物 (IV-a-2) または (IV-b-2) に対して通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 2 モル当量) である。

本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 2 に示される反応のうち第 1 段階の反応と同様である。

反応図式 3 5 の原料化合物である化合物 (IV-a-2)、(IV-b-2) またはそれら

の塩は以下の反応図式 3 6 に従って製造することができる。なお下記に示す化合物 (VI-a-2) 及び (VI-b-2) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 3 6



5

[式中の記号は前記と同意義を示す。]

本反応においては化合物 (VII) またはその塩を通常 1 モル当量以上 (好ましくは 1 ~ 10 モル当量) の化合物 (VI-a-2)、(VI-b-2) またはそれらの塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては反応図式 3 で示される反応と同様の溶媒が用いられる。

10

本反応は一般に塩基の存在下に行うのが好ましく、このような塩基としては反応図式 3 で示される反応と同様の塩基が用いられる。塩基は化合物 (VII) に対して通常 1 ~ 5 モル当量用いられる。また反応を加速させるためにヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム等のヨウ化物または 18-クラウン-6、15-クラウン-5 等の相間移動触媒を添加してもよい。ここで用いられるヨウ化物または相間移動触媒は化合物 (VII) に対して通常触媒量 ~ 1 モル当量程度用いられる。

15

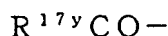
本反応の反応温度、反応の完結に要する時間、反応の終了の確認法等は反応図式 3 で示される反応と同様である。

20

反応図式 3 6 の原料化合物である化合物 (VI-a-2)、(VI-b-2) またはそれらの塩は例えば、 $\alpha$ -ハロケトン (あるいはアルデヒド) 化合物のアセタール化合

物（例、プロモアセトアルデヒドジエチルアセタール等）または $\beta$ -ハロケトン（あるいはアルデヒド）化合物のアセタール化合物（例、3-プロモプロピオンアルデヒドジメチルアセタール等）であり、これらは公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。

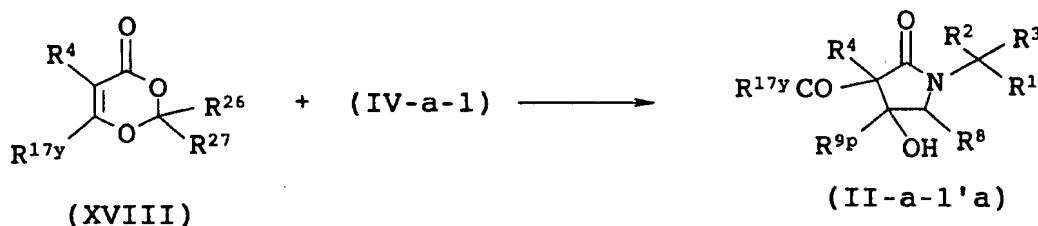
5 本発明の化合物 (II-a-1') またはその塩のうち、基 Z が式



（式中、 $R^{17y}$  はハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を示す。）で表される基を示す場合に該当する化合物 (II-a-1'a) またはその塩は以下の反応図式 37 に従って製造することもできる。なお下記に示す化合物 (XV

10 III) の塩としては上記した化合物 (I) の塩と同様のものが用いられる。

反応図式 37



[式中、 $R^{26}$  及び  $R^{27}$  はそれぞれ  $C_{1-6}$  アルキル基を示すか、または  $R^{26}$  及び  $R^{27}$  は隣接する炭素原子と一緒になってシクロペンタン-1, 1-ジイルまたはシクロヘキサン-1, 1-ジイルを形成してもよく、他の記号は前記と同意義を示す。]

15

$R^{17y}$  で示されるハロゲン（例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等）で 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基としては例えば、メチル、エチル、トリフルオロメチル等が用いられる。 $R^{26}$  または  $R^{27}$  で示される  $C_{1-6}$  アルキル基としては例えば、メチル、エチル等が用いられる。

20

本反応においては化合物 (IV-a-1) またはその塩を通常 1 モル当量以上（好ましくは 1～2 モル当量）の化合物 (XVIII) またはその塩と反応させる。本反応は反応に悪影響を与えない溶媒中で行うことができ、適当な溶媒としては例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類等が用いられる。

25 本反応の反応温度は通常約 0～200℃、好ましくは約 70～150℃である。

本反応は30分～30時間程度で完結し、その終了は薄層クロマトグラフィ、高速液体クロマトグラフィ等により確認できる。

反応図式37の原料化合物である化合物(XVIII)またはその塩は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から容易に製造することができる。例えば、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン[Chemical and Pharmaceutical Bulletin]第31巻、1896頁(1983年)、テトラヘドロン[Tetrahedron]第51巻、2585頁(1995年)等に記載されている方法またはそれに準じる方法により製造できる。

上記の反応図式1～37に従って製造される各化合物は分子中にスルホ基、カルボキシル基等の酸性基を有する場合、反応において塩基を用いた場合には塩基との塩として得られることもある。このような場合には必要に応じて例えば、塩酸、硫酸、リン酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸を添加することにより遊離型に導くことができ、当該化合物が遊離型で得られる場合には水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、アンモニア等の無機塩基、トリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基を加えて塩基塩とすることができる。

また上記の反応図式1～37に従って製造される各化合物は分子中に塩基性の窒素原子またはアミノ基等の塩基性基を有する場合、上記した無機酸または有機酸との酸付加塩とすることができる。当該化合物が遊離型で得られる場合には上記した無機酸または有機酸を加えて酸付加塩とことができ、当該化合物が酸付加塩として得られる場合には上記した塩基を加えて遊離型に導くことができる。

上記の反応図式1～37に従って製造される各化合物またはその塩は自体公知の手段、例えば濃縮、減圧濃縮、抽出、転溶、結晶化、再結晶化、クロマトグラフィ等により単離・精製することができる。


## 実施例

以下に参考例、実施例、製剤例及び試験例を示し、本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらの例により制限されるべきものではない。

参考例及び実施例中、室温とは通常約10～30℃を示す。<sup>1</sup>H-NMRとは

プロトン核磁気共鳴スペクトルを示し、内部標準としてテトラメチルシランを用いてブルカーAC200P型スペクトロメーター（200MHz）で測定し、ケミカルシフト（ $\delta$ ）をppmで示した。またIRとは赤外吸収スペクトルを示し、パーキンエルマーパラゴン1000型FT-IRスペクトロメーターで測定し、  
5 吸収帯位置を波数（ $\text{cm}^{-1}$ ）で示した。

参考例及び実施例中のその他の記号は次のような意味を有するものである。DMSO- $d_6$ ：重ジメチルスルホキシド； $\text{CDCl}_3$ ：重クロロホルム；s：シングレット；d：ダブルット；t：トリプレット；q：クワルテット；dd：ダブルットダブルット；dt：ダブルットトリプレット；td：トリプレットダブルット；ddd：ダブルットダブルットダブルット；ABq：ABクワルテット；m：マルチプレット；br.：ブロード（幅広い）；J：カップリング定数；%：重量パーセント；v/v：体積対体積比；Me：メチル；Et：エチル；n-Pr：ノルマルプロピル；iso-Pr：イソプロピル；tert-Bu：ターシャリーブチル；Ph：フェニル；2-F-Ph：2-フルオロフェニル；2-Me-Ph：2-メチルフェニル；Ac：アセチル；dec.：分解；  
10  
15

 : シクロプロピル

本発明の化合物（I）、（II）、（II'）またはそれらの塩の製造原料となる化合物（例えば、（IV-a-1）、（IV-b-1）、（IV-c-1）、（IV'-a-2）、（IV'-a-3）、（V'）等）またはその塩のうち新規な化合物についてその製造法を以下の参考例1～10に示す。  
20

参考例1 N-（1-（3，5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチル）プロパルギルアミン（化合物番号IV-3-1）

1-（3，5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチルアミン2.0g（9.8mmol）、炭酸カリウム1.5g（0.011mol）及びDMF10mlの混合物を室温下攪拌し、これに臭化プロパルギル1.3g（0.011mol）を加えた。反応混合物を外温70℃で4時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物を水にあげ、ジエチルエーテルで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ヘキサン  
25

—酢酸エチル、2 : 1、v/v) により精製し、標記化合物 1. 2 g を黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 3~1. 5 (7H, m), 2. 19 (1H, t,  $J=2. 5\text{ Hz}$ ), 3. 13 (2H, d,  $J=2. 5\text{ Hz}$ ), 7. 23 (1H, t,  $J=1. 9\text{ Hz}$ ), 7. 33 (2H, d,  $J=1. 9\text{ Hz}$ )

IR (neat) 3302, 1584, 1562, 1413, 858, 797

参考例2 2-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-1-シクロプロピル-1-エタノン (化合物番号IV-1-1)

シクロプロピルメチルケトン 5. 0 g (0. 059 mol) のメタノール 60 ml 中溶液を冷却下攪拌し、これに臭素 3. 3 ml (0. 064 mol) を 10 分で滴下した (内温 -3~0℃)。反応混合物を室温下 15 分攪拌した。反応混合物に飽和食塩水 120 ml を加え、ジエチルエーテルで抽出した (30 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、飽和食塩水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液ついで飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮してプロモメチルシクロプロピルケトンの粗生成物 11. 1 g を無色油状物として得た。

1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミン 2. 0 g (9. 8 mmol)、炭酸カリウム 2. 7 g (0. 020 mol)、ヨウ化カリウム 0. 16 g (0. 96 mmol) 及び DMF 6 ml の混合物を氷冷下攪拌し、これにプロモメチルシクロプロピルケトンの粗生成物 4. 3 g (0. 020 mol) を加えた。反応混合物を室温下一夜攪拌した。反応混合物に水 15 ml を加え、ジエチルエーテルで抽出した (15 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄後、1 N 塩酸で抽出した (5 ml  $\times$  3)。この酸性抽出液を合し、ジエチルエーテルで洗浄後、10% 水酸化ナトリウム水溶液を加えて pH を 11 とした。このものをジエチルエーテルで抽出した (10 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、2 : 1、v/v) により精製し、標記化合物 1. 35 g を黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  0. 84~1. 11 (4H, m), 1. 43 (

6H, s), 1.72~1.89 (1H, m), 2.16 (1H, br. s),  
3.45 (2H, s), 7.20~7.34 (3H, m)

IR (neat) 3329, 1704, 1585, 1563, 1414, 1383, 1223, 1194, 1070, 858, 797

5

参考例3 3-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-2-ペンタノン (化合物番号IV-1-2)

1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミン2.0g (9.8mmol)、炭酸カリウム2.7g (0.020mol)、ヨウ化カリウム1.4g (8.6mmol)、18-クラウン-6 0.50g (1.9mmol)  
10 及びDMF 10mlの混合物を室温下攪拌し、これに3-クロロ-2-ペンタノン4.1g (0.034mol)を加えた。反応混合物を外温50℃で2時間ついで外温70℃で7時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物に氷水30mlを加え、ジエチルエーテルで抽出した(20ml×2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗  
15 浄後、1N塩酸で抽出した(5ml×4)。この酸性抽出液を合し、ジエチルエーテルで洗浄後、10%水酸化ナトリウム水溶液を加えてpHを10とした。このものをジエチルエーテルで抽出した(20ml×2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、3:1、v/v)により精製し、標記化合物0.48gを黄色油状物として得た。  
20

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  0.85 (3H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 1.23~1.61 (8H, m), 2.06 (3H, s), 2.67 (1H, br. s), 2.99 (1H, dd,  $J=6.3, 5.3\text{Hz}$ ), 7.21 (1H, t,  $J=1.9\text{Hz}$ ), 7.35 (2H, d,  $J=1.9\text{Hz}$ )

25 IR (neat) 3318, 1715, 1586, 1563, 1459, 1414, 1384, 1362, 1247, 1233, 1183, 1125, 858, 797, 694

参考例4 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)



) - 2 - メチル - 3 - ブタノン (化合物番号 IV - 2 - 1)

1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチルアミン 2.1 g (0.010 mol) 及び 3 - メチル - 3 - ブテン - 2 - オン 1.3 g (0.015 mol) の混合物を外温 80℃ で 8 時間加熱撹拌した。反応混合物に更に 3 - メチル - 3 - ブテン - 2 - オン 1.3 g (0.015 mol) を加え、外温 80℃ で更に 8 時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン - 酢酸エチル、2 : 1、v/v) により精製し、標記化合物 1.3 g を淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.08 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.3~1.4 (6H, m), 1.46 (1H, br. s), 2.14 (3H, s), 2.2~2.4 (1H, m), 2.5~2.7 (2H, m), 7.21 (1H, t,  $J=1.9\text{ Hz}$ ), 7.31 (2H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ )

IR (neat) 3330, 1710, 1585, 1562, 1413, 1383, 1360, 857, 796

15

参考例 5 1 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチルアミノ) - 3 - メチルチオ - 2 - プロパノン (化合物番号 IV - 1 - 5)

(1) N - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチル) - 2, 3 - エポキシプロピルアミン (化合物番号 IV - 1 - 3)

20 1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルエチルアミン 6.0 g (0.029 mol)、炭酸カリウム 8.1 g (0.059 mol) 及び DMF 30 ml の混合物にエピブロモヒドリン 4.8 ml (0.059 mol) を加え、外温 80℃ で 3 時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物に氷水 50 ml を加え、ジエチルエーテルで抽出した (30 ml  $\times$  2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (クロロホルム - アセトン、12 : 1、v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号 IV - 1 - 3) 4.7 g を無色油状物として得た。

25

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.42 (6H, s), 2.37 (1H, dd,  $J=12.5, 5.9\text{ Hz}$ ), 2.60~2.66 (1H, m), 2.75 (1

H, dd,  $J=5.0, 4.0$  Hz), 3.02~3.12 (1H, m), 4.32~4.64 (1H, m), 7.22 (1H, t,  $J=1.9$  Hz), 7.34 (2H, d,  $J=1.9$  Hz)

IR (neat) 3331, 1585, 1563, 1480, 1413, 1385, 1258, 1227, 1179, 1093, 1068, 856, 797, 693

(2) N-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-2-ヒドロキシ-3-メチルチオプロピルアミン (化合物番号IV-1-4)

10 参考例5の(1)で調製した化合物(IV-1-3) 4.7 g (0.018 mol) のジオキサン15 ml 中溶液を氷冷下撹拌し、これに15%ナトリウムチオメトキシド水溶液9.5 ml (0.020 mol) を15分で滴下した。反応混合物を室温下2時間撹拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル50 ml と混合した。このものを飽和食塩水で洗浄し(30 ml  $\times$  2)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、2:3、v/v)により精製し、標記化合物(化合物番号IV-1-4) 3.9 g を淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.44 (6H, s), 2.11 (3H, s), 2.33 (1H, dd,  $J=11.7, 7.5$  Hz), 2.45~2.55 (3H, m), 3.65~3.80 (1H, m), 7.22 (1H, t,  $J=1.9$  Hz), 7.33 (2H, d,  $J=1.9$  Hz)

IR (neat) 3600~3000, 1585, 1563, 1413, 1384, 1232, 1183, 1097, 858, 798, 693

25 (3) 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-3-メチルチオ-2-プロパノン (化合物番号IV-1-5)

DMSO 3.6 ml (0.051 mol) のジクロロメタン35 ml 中溶液を内温-60℃に冷却下撹拌し、これに塩化オキサリル2.2 ml (0.026 mol) のジクロロメタン2 ml 中溶液を10分で滴下した。反応混合物を内温-

60℃で20分撹拌した後、これに参考例5の(2)で調製した化合物(IV-1-4) 3.9 g (0.013 mol) のジクロロメタン10 ml 中溶液を10分で滴下した。反応混合物を内温-60℃で20分撹拌した後、これにトリエチルアミン14 ml (0.10 mol) を10分で滴下した。反応混合物を撹拌しながら徐々に室温まで昇温させた。反応混合物に水50 ml を加え、有機層を分離し、水層をクロロホルム10 ml で抽出した。抽出液及び先の有機層を合し、水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v)により精製し、標記化合物(化合物番号IV-1-5) 2.0 g を黄色油状物として得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.44 (6H, s), 2.06 (3H, s), 3.14 (2H, s), 3.49 (2H, s), 7.23 (1H, t, J=1.9 Hz), 7.29 (2H, d, J=1.9 Hz)

IR (neat) 3330, 1711, 1585, 1563, 1414, 1384, 1364, 1228, 1185, 1076, 858, 798, 693

参考例5で示される実験をくりかえし行い、化合物(IV-1-5)を更に1.0 g 得た。

参考例6 2-メチル-2-(2-オキソブチルアミノ)プロパン酸ベンジル(化合物番号IV'-2-1)

2-アミノイソ酪酸ベンジルのp-トルエンスルホン酸塩15.0 g (0.041 mol)、トリエチルアミン12.4 g (0.123 mol) 及びDMF 100 ml の混合物を室温下撹拌し、これに1-クロロ-2-ブタノン9.0 g (0.084 mol) を加え、外温70℃で4時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物を水200 ml にあけ、酢酸エチルで抽出した(100 ml × 2)。抽出液を合し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、1:1、v/v)により精製し、標記化合物7.7 g を淡黄色油状物として得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.05 (3H, t, J=7.4 Hz), 1.35 (6H, s), 2.10 (1H, br. s), 2.31 (2H, q, J=7.

4 Hz), 3.39 (2H, s), 5.11 (2H, s), 7.33 (5H, s)

IR (neat) 3331, 1724, 1457, 1259, 1236, 1142, 751, 698

5

参考例7 2-メチル-2-(3-メチルチオ-2-オキソプロピルアミノ)プロパン酸tert-ブチル(化合物番号IV'-3-3)

(1) 2-(2,3-エポキシプロピルアミノ)-2-メチルプロパン酸tert-ブチル(化合物番号IV'-3-1)

10 2-アミノ-2-メチルプロパン酸tert-ブチル2.0g(0.013mol)、炭酸カリウム3.5g(0.025mol)及びDMF15mlの混合物にエピブromヒドリン2.1ml(0.026mol)を加え、外温80℃で2時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物に氷水30mlを加え、ジエチルエーテルで抽出した(20ml×2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ

15 フィ(ヘキサン-酢酸エチル、1:1, v/v)により精製し、標記化合物(化合物番号IV'-3-1)1.5gを黄色油状物として得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.26, 1.28 (6H, each s), 1.45 (9H, s), 1.79 (1H, br. s), 2.51~2.63 (2 H, m), 2.74~2.83 (2H, m), 3.03~3.13 (1H, m)

20 IR (neat) 3330, 1721, 1466, 1368, 1276, 1253, 1140, 850

(2) 2-(2-ヒドロキシ-3-メチルチオプロピルアミノ)-2-メチルプロパン酸tert-ブチル(化合物番号IV'-3-2)

25

参考例7の(1)で調製した化合物(IV'-3-1)1.5g(7.1mmol)のジオキサン10ml中溶液を氷冷下撹拌し、これに15%ナトリウムチオメトキシド水溶液4.0ml(8.6mmol)を加えた。反応混合物を室温下2時間撹拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル40mlと混合

した。このものを飽和食塩水で洗浄し（２回）、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ヘキサンーアセトン、２：１、v/v）により精製し、標記化合物（化合物番号IV' - 3 - 2） 1. 1 gを無色油状物として得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 27 (6H, s), 1. 46 (9H, s), 2. 14 (3H, s), 2. 44~2. 78 (4H, m), 3. 66~3. 80 (1H, m)

IR (neat) 3615~3067, 1724, 1463, 1368, 1278, 1254, 1140, 850

10 参考例7の（１）及び（２）で示される実験をくりかえし行い、化合物（IV' - 3 - 2）を更に8. 7 g得た。

（３）２－メチル－２－（３－メチルチオ－２－オキソプロピルアミノ）プロパン酸tert-ブチル（化合物番号IV' - 3 - 3）

15 DMSO 11. 1 ml (0. 157 mol) のジクロロメタン 130 ml 中溶液を内温 - 70 ~ - 65 °C に冷却下攪拌し、これに塩化オキサリル 6. 7 ml (0. 078 mol) を15分で滴下した。反応混合物を同温で20分攪拌した後、これに参考例7の（２）で調製した化合物（IV' - 3 - 2）9. 8 g (0. 037 mol) のジクロロメタン 5 ml 中溶液を15分で滴下した（内温 - 75 ~ - 70 °C）。反応混合物を同温で30分攪拌した後、これにトリエチルアミン 28 ml (0. 20 mol) を15分で滴下した（内温 - 50 °C）。反応混合物を攪拌しながら徐々に内温 0 °C まで昇温させた。反応混合物に水 150 ml を加え、有機層を分離し、水層をジエチルエーテル 100 ml で抽出した。先の有機層を減圧下濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテル 100 ml に溶解し、抽出液と  
20 合した。このものを水洗し（50 ml × 2）、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ヘキサンー酢酸エチル、1 : 1、v/v）により精製し、標記化合物（化合物番号IV' - 3 - 3） 1. 4 g を黄褐色油状物として得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 30 (6H, s), 1. 44 (9H, s),

2. 10 (3H, s), 3. 20 (2H, s), 3. 69 (2H, s)

IR (neat) 3330, 1719, 1459, 1368, 1275, 1249, 1140, 850

5 参考例8 2-(2-フルオロフェニル)マロン酸モノメチル(化合物番号V'-1-1)

(1) 2-(2-フルオロフェニル)マロン酸ジメチル(化合物番号V'-2-1)

ナトリウム2.0g(0.087mol)を乾燥メタノール50mlに溶解した。この溶液を減圧下濃縮し、得られた残渣にトルエン50ml、(2-フルオロフェニル)アセトニトリル11.7g(0.084mol)ついで炭酸ジメチル37.0g(0.40mol)を加えた。反応混合物を外温100℃で3時間加熱攪拌した。この間に生成するメタノールを蒸留により除去した。冷後、反応混合物を氷水50mlにあげ、このものに酢酸8.5mlを加えてpHを5とした。有機層を分離し、水層をジエチルエーテルで抽出した(20ml×2)。抽出液を先の有機層と合し、水洗し(20ml×3)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物(暗褐色透明油状物)15.9gを得た。このものを蒸留し、2-シアノ-2-(2-フルオロフェニル)酢酸メチル10.5gを無色透明油状物として得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.83 (3H, s), 5.04 (1H, s), 7.04~7.32 (2H, m), 7.32~7.60 (2H, m)

IR (neat) 2254, 1755, 1618, 1592, 1496, 1459, 1437, 1242, 759

25 2-シアノ-2-(2-フルオロフェニル)酢酸メチル10.5g(0.054mol)の乾燥メタノール40ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化水素ガスを飽和するまで吹き込んだ。反応混合物を室温下一夜攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣に水150mlを加え、炭酸ナトリウムを加えてpHを10とし、酢酸エチルで抽出した(2回)。抽出液を合し、約50mlになるまで減圧下濃縮

した。このものに10%硫酸100mlを加え、室温下1時間ついで外温50℃で3時間攪拌した。有機層を分離し、水層を酢酸エチルで抽出した。抽出液と先の有機層を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ヘキサン-酢酸エチル、  
5 4:1、v/v）により精製し、標記化合物（化合物番号V'-2-1）5.4gを無色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.78 (6H, s), 5.02 (1H, s), 7.04~7.21 (2H, m), 7.26~7.52 (2H, m)

IR (neat) 1741, 1495, 1436, 1234, 1152, 75  
10 6

(2) 2-(2-フルオロフェニル)マロン酸モノメチル（化合物番号V'-1-1）

参考例8の(1)で調製した化合物(V'-2-1) 5.4g (0.024mol) のメタノール40ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに水酸化カリウム1.6g (0.024mol) の水20ml中溶液を30分で滴下した。反応液を室温下4時間攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を水と混合し、ジエチルエーテルで洗浄した後、1N塩酸を加え、pHを2としてジエチルエーテルで抽出した（3回）。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して標記化合物（化合物番号V'-1-1）3.3gを無色油状物として得た。  
15 20

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.79 (3H, s), 5.02 (1H, s), 7.04~7.21 (2H, m), 7.28~7.50 (2H, m)

IR (neat) 3600~2500, 1744, 1494, 1297, 1235, 1161, 1094, 1016, 758

25

参考例8の(2)と同様の方法により2-(2-メチルフェニル)マロン酸ジメチル5.4g (0.024mol) から2-(2-メチルフェニル)マロン酸モノメチル（化合物番号V'-1-2）3.3gを白色結晶として得た。

mp 75~77℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  2.36 (3H, s), 3.78 (3H, s),  
4.92 (1H, s), 7.18~7.40 (4H, m)

IR (nujol) 3300~2854, 1753, 1710, 1460, 1  
432, 1418, 1313, 1265, 1240, 1222, 1203, 10  
5 15, 728

参考例9 N-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-3,  
3-ジメトキシプロピルアミン (化合物番号IV-2-2)

1- (3, 5-ジクロロフェニル) -1-メチルエチルアミン1.0g (4.  
10 9mmol), 3-ブロモプロピオンアルデヒドジメチルアセタール (90%)  
1.0g (4.9mmol), 炭酸カリウム0.83g (6.0mmol) 及び  
DMF 7mlの混合物を外温90℃で23時間加熱攪拌した。冷後、不溶物をろ  
取し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣に水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。  
抽出液を水洗し (2回)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られ  
15 た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (クロロホルム-メタノール、10  
: 1, v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号IV-2-2) 1.0gを  
淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.41 (6H, s), 1.6~1.8 (2H,  
m), 2.39 (2H, t,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 3.32 (6H, s), 4.4  
20 5 (1H, t,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 7.21 (1H, t,  $J=1.9\text{Hz}$ ), 7.  
32 (2H, d,  $J=1.9\text{Hz}$ )

参考例10 1-(1-(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル)-1-メチルエチ  
ルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-1)

25 (1) 1-(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル)-1-メチルエチルアミン (化  
合物番号VII-1-1)

塩化セリウム7水和物9.4g (0.024mol)を粉碎し、減圧下 (0.  
2mmHg)、外温100℃で0.5時間ついで外温140℃で3.5時間加熱  
乾燥した。冷後、乾燥窒素気流下このものに乾燥THF 80mlを加え、室温下



1. 5時間撹拌した。このものを内温 $-70^{\circ}\text{C}$ に冷却下撹拌し、これにメチルリチウムのジエチルエーテル溶液(1.02M) 25ml (0.026mol)を徐々に滴下し、同温で75分撹拌した。反応混合物に2,6-ジクロロピリジン-4-カルボニトリル1.4g (8.1mmol)の乾燥THF 15ml中溶液を内温 $-70^{\circ}\text{C}$ で滴下し、同温で3時間撹拌した。反応混合物に25%アンモニア水30mlを加え、室温下一夜撹拌した。不溶の固体をろ取り、クロロホルムで洗浄した。ろ液に飽和食塩水100mlを加え、有機層を分離した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をクロロホルム80mlと混合し、1N塩酸で抽出した(30ml $\times$ 2)。抽出液を合し、10%水酸化ナトリウム水溶液を加えてpHを11とし、クロロホルムで抽出した(50ml $\times$ 3)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して標記化合物(化合物番号VII-1-1) 1.1gを淡赤色結晶として得た。

mp  $94\sim 95^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.46 (6H, s), 1.55 (2H, br. s), 7.41 (2H, s)

IR (nujol) 3372, 1584, 1537, 1365, 1167, 861, 805

(2) 1-(1-(2,6-ジクロロ-4-ピリジル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン(化合物番号IV-4-1)

参考例10の(1)で調製した化合物(VII-1-1) 1.1g (5.3mmol)、炭酸カリウム0.89g (6.4mmol)、ヨウ化カリウム0.090g (0.54mmol)及びDMF 10mlの混合物を氷冷下撹拌し、これにクロロアセトン1.0g (0.012mol)のDMF 5ml中溶液を滴下した。反応混合物を外温 $45^{\circ}\text{C}$ で3時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物に水50mlを加え、ジエチルエーテルで抽出した(50ml $\times$ 2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィにより2回くりかえし精製し(1回目:ヘキサン-酢酸エチル、1:1、v/v; 2回目:ヘキサン-ジエチルエーテル、1:

2、v/v)、標記化合物(化合物番号IV-4-1) 0.51gを白色結晶として得た。

mp 65~66°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.41 (6H, s), 2.12 (3H, s),  
5 3.30 (2H, s), 7.30 (2H, s)

IR (nujol) 3327, 1719, 1579, 1532, 1179, 812

10 参考例10の(1)と同様の方法により以下の化合物を合成した。これらの化合物のうち固体のものについてはmpを、油状物、樹脂状物またはロウ状固体のものについては<sup>1</sup>H-NMRスペクトルデータを示す。

1-(2-クロロ-4-ピリジル)-1-メチルエチルアミン(化合物番号VI  
I-1-2): <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.47 (6H, s), 1.63 (2H, br. s), 7.34 (1H, dd, J=1.7, 5.3 Hz), 7.4  
15 8 (1H, dd, J=0.6, 1.7 Hz), 8.32 (1H, d, J=5.3 Hz)

1-(6-クロロ-2-ピリジル)-1-メチルエチルアミン(化合物番号VI  
I-1-3): <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.49 (6H, s), 1.90 (2H, s), 7.16 (1H, dd, J=0.8, 7.8 Hz), 7.36 (1  
20 H, dd, J=0.8, 7.8 Hz), 7.60 (1H, t, J=7.8 Hz)

1-メチル-1-(2-キノリル)エチルアミン(化合物番号VII-1-4)  
: <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.59 (6H, s), 2.18 (2H, br. s), 7.49 (1H, ddd, J=8.1, 7.0, 1.2 Hz), 7.58  
(1H, d, J=8.6 Hz), 7.69 (1H, ddd, J=8.1, 7.0,  
25 1.6 Hz), 7.79 (1H, dd, J=8.0, 1.2 Hz), 8.00~8.18 (2H, m)

1-メチル-1-(3-キノリル)エチルアミン(化合物番号VII-1-5)  
: <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.63 (6H, s), 1.80 (2H, br. s), 7.53 (1H, ddd, J=8.1, 6.9, 1.3 Hz), 7.68

(1H, ddd,  $J=8.4, 6.9, 1.6$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J=8.0, 1.3$  Hz), 8.02~8.14 (1H, m), 8.20~8.27 (1H, m), 9.12 (1H, d,  $J=2.4$  Hz)

1-(3-イソキノリル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-6) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.62 (6H, s), 7.40~8.15 (5H, m), 9.23 (1H, s)

1-(3-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-7) : mp 113~114°C

1-メチル-1-(4-メチル-2-キナゾリニル)エチルアミン (化合物番号VII-1-8) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.62 (6H, s), 2.93 (3H, s), 7.57 (1H, ddd,  $J=1.3, 6.8, 8.2$  Hz), 7.83 (1H, ddd,  $J=1.4, 6.8, 8.4$  Hz), 7.92~8.12 (2H, m)

1-(1,4-ベンゾジオキシン-2-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-9) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.28 (6H, s), 1.63 (2H, br. s), 5.95 (1H, s), 6.57~6.92 (4H, m)

1-メチル-1-(6-キノリル)エチルアミン (化合物番号VII-1-10) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.60 (6H, s), 1.79 (2H, br. s), 7.39 (1H, dd,  $J=8.3, 4.2$  Hz), 7.81~7.97 (2H, m), 8.01~8.09 (1H, m), 8.09~8.21 (1H, m), 8.88 (1H, dd,  $J=4.2, 1.7$  Hz)

1-(1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-11) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.41 (6H, s), 1.59 (2H, br. s), 5.86 (2H, s), 6.56 (1H, d,  $J=8.4$  Hz), 6.77 (1H, d,  $J=2.3$  Hz), 6.93 (1H, dd,  $J=8.4, 2.3$  Hz)

1-(8-クロロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-12) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.40

(6H, s), 1.55 (2H, br. s), 5.89 (1H, d,  $J=3.6$  Hz), 5.97 (1H, d,  $J=3.6$  Hz), 6.68 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.03 (1H, d,  $J=2.2$  Hz)

5 1-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-13):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.45 (6H, s), 1.60 (2H, br. s), 4.25 (4H, s), 6.82 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 6.94~7.01 (2H, m)

10 1-(8-クロロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-14):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.44 (6H, s), 1.66 (2H, br. s), 4.26~4.29 (2H, m), 4.33~4.35 (2H, m), 6.93 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.09 (1H, d,  $J=2.2$  Hz)

15 1-(ベンゾフラン-5-イル)-1-メチルエチルアミン (化合物番号VII-1-15):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.57 (6H, s), 2.09 (2H, br. s), 6.74 (1H, d,  $J=1.8$  Hz), 7.45~7.53 (2H, m), 7.61 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.75 (1H, d,  $J=1.5$  Hz)

20 参考例10の(2)と同様の方法により化合物(VII-1-2)~(VII-1-15)から以下の化合物を合成した。これらの化合物の $^1\text{H-NMR}$ スペクトルデータを示す。

25 1-(1-(2-クロロ-4-ピリジル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-2):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.43 (6H, s), 2.10 (3H, s), 3.29 (2H, d,  $J=0.6$  Hz), 7.24 (1H, dd,  $J=1.6, 5.3$  Hz), 7.35 (1H, dd,  $J=0.6, 1.6$  Hz), 8.32 (1H, dd,  $J=0.6, 5.3$  Hz)

1-(1-(6-クロロ-2-ピリジル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-3):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.47 (6H, s), 2.09 (3H, s), 3.34 (2H, s), 7.16 (1H,

dd,  $J=7.8, 0.8\text{ Hz}$ ), 7.33 (1H, dd,  $J=7.8, 0.8\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, t,  $J=7.8\text{ Hz}$ )

1 - (1-メチル-1-(2-キノリル)エチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-4):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.59 (6H, s),  
5 2.05 (3H, s), 3.39 (2H, s), 7.42~7.87 (4H, m), 7.95~8.19 (2H, m)

1 - (1-メチル-1-(3-キノリル)エチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-5):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.59 (6H, s),  
10 2.06 (3H, s), 3.34 (2H, d,  $J=0.5\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, ddd,  $J=8.1, 6.9, 1.3\text{ Hz}$ ), 7.70 (1H, ddd,  $J=8.5, 6.9, 1.6\text{ Hz}$ ), 7.81 (1H, dd,  $J=8.1, 1.4\text{ Hz}$ ), 8.01~8.14 (2H, m), 9.05 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )

1 - (1-(3-イソキノリル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-6):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.59 (6H, s),  
15 2.04 (3H, s), 3.31 (2H, d,  $J=0.5\text{ Hz}$ ), 7.46~7.85 (4H, m), 7.88~8.00 (1H, m), 9.22 (1H, s)

20 1 - (1-(3-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-7):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.52 (6H, s), 2.08 (3H, s), 2.20 (1H, br. s), 3.33 (2H, s), 7.35 (1H, dd,  $J=1.3, 9.6\text{ Hz}$ ), 7.54~7.59 (2H, m), 8.00 (1H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ )

25 1 - (1-メチル-1-(4-メチル-2-キナゾリニル)エチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-8):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.61 (6H, s), 2.07 (3H, s), 2.91 (3H, s), 3.41 (2H, d,  $J=0.5\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, ddd,  $J=1.4, 6.8, 8.2\text{ Hz}$ ), 7.83 (1H, ddd,  $J=1.5, 6.8, 8.3\text{ Hz}$ ),

7. 91~8. 13 (2H, m)

1-(1-(1, 4-ベンゾジオキシシ-2-イル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-9):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )

5  $\delta$  1. 24 (6H, s), 1. 97~2. 20 (1H, br. s), 2. 14 (3H, s), 3. 50 (2H, d,  $J=0. 5\text{Hz}$ ), 5. 88 (1H, s), 6. 56~6. 73 (2H, m), 6. 73~6. 91 (2H, m)

1-(1-メチル-1-(6-キノリル)エチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-10):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 57 (6H, s), 2. 05 (3H, s), 3. 32 (2H, s), 7. 40 (1H, dd,  $J=8. 3, 4. 2\text{Hz}$ ), 7. 72~7. 91 (2H, m), 8. 01~8. 24 (2H, m), 8. 89 (1H, dd,  $J=4. 2, 1. 7\text{Hz}$ )

1-(1-(1, 4-ベンゾジオキシシ-6-イル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-11):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 37 (6H, s), 1. 97 (1H, br. s), 2. 08 (3H, s), 3. 29 (2H, s), 5. 86 (2H, s), 6. 55 (1H, d,  $J=8. 4\text{Hz}$ ), 6. 66 (1H, d,  $J=2. 2\text{Hz}$ ), 6. 81 (1H, dd,  $J=8. 3, 2. 3\text{Hz}$ )

1-(1-(8-クロロ-1, 4-ベンゾジオキシシ-6-イル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-12):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 35 (6H, s), 2. 10 (3H, s), 3. 29 (2H, s), 5. 89 (1H, d,  $J=3. 6\text{Hz}$ ), 5. 97 (1H, d,  $J=3. 6\text{Hz}$ ), 6. 58 (1H, d,  $J=2. 2\text{Hz}$ ), 6. 90 (1H, d,  $J=2. 2\text{Hz}$ )

1-(1-(2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシシ-6-イル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン (化合物番号IV-4-13):  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 41 (6H, s), 1. 85 (1H, br. s), 2. 06 (3H, s), 3. 30 (2H, s), 4. 25 (4H, s), 6. 82~6. 89 (3H, m)

1-(1-(8-クロロ-2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシシ-6

5      -イル) -1-メチルエチルアミノ) -2-プロパノン (化合物番号IV-4-14) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.39 (6H, s), 2.08 (3H, s), 3.29 (2H, s), 4.25~4.28 (2H, m), 4.33~4.35 (2H, m), 6.82 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 6.96 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ )

10      1-(1-(ベンゾフラン-5-イル) -1-メチルエチルアミノ) -2-プロパノン (化合物番号IV-4-15) :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.52 (6H, s), 2.04 (3H, s), 2.17 (1H, br. s), 3.31 (2H, s), 6.74 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.35 (1H, dd,  $J=1.9, 8.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, s), 7.61 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ )

15      本発明の化合物 (I)、(II)、(II') またはそれらの塩の代表的な製造法を以下の実施例 1~37 に示す。またここでは化合物 (I)、(II)、(II') またはそれらの塩を製造するための環形成反応の原料化合物 (例えば、化合物 (III-c-1)、(III-a-3)、(III-b-1)、(III'-a-2) 等) またはその塩についても代表的な製造法をあわせて示す。

20      実施例 1    メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル) -1-メチルエチル) -4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-1-1)

(1) 2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチル

25      フェニルマロン酸モノメチル 4.3 g (0.022 mol) 及び 1,2-ジクロロエタン 40 ml の混合物に室温下、塩化チオニル 3.4 g (0.029 mol) を加え、外温 70~80℃ で 1 時間ついで外温 100℃ で 1 時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物 (溶液) を減圧下濃縮し、2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物 4.9 g を淡黄色透明油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.84 (3H, s), 5.06 (1H, s), 7.43 (5H, s)

IR (neat) 3067, 3034, 2956, 1790, 1745, 1498, 1456, 1436, 1302, 1260, 1206, 1156, 1033, 1008, 973, 799, 725, 566

- 5 (2) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-1-1)

- 1- (1- (3, 5-ジクロロフェニル) -1-メチルエチルアミノ) -2-プロパノン5. 2 g (0. 020 mol) 及びトリエチルアミン2. 6 g (0. 026 mol) の乾燥THF 45 ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1の  
10 (1) で調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物4. 9 g (0. 022 mol) の乾燥THF 45 ml 中溶液を20分で滴下した。反応混合物を氷冷下1時間ついで室温下65時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に氷水50 ml を加え、酢酸エチルで抽出した(30 ml × 3)。  
15 抽出液を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(20 ml × 1) ついで飽和食塩水(20 ml × 2) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物9. 6 g (淡黄褐色固体) を得た。このものをジエチルエーテル20 ml -酢酸エチル10 ml の混合液で洗浄し、粉碎した。不溶の固体をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄(×2)、風乾して標記化合物(化合物番号II-1-1)  
20 4. 3 g を白色粉末として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった(異性体比は<sup>1</sup>H-NMRから68:32)。

mp 154~156℃

- <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1. 15~1. 27 (1H, m), 1. 53 (3H, s), 1. 68 (3H, s), 1. 73 (3H, s), 3. 57 (1H, d, J=9. 7 Hz), 3. 76 (3H, s), 3. 92 (1H, dd, J=2. 2, 9. 7 Hz), 7. 17~7. 50 (8H, m) (以上、多い方の異性体)  
25 ; 1. 06 (3H, s), 1. 63 (3H, s), 1. 84 (3H, s), 3. 36 (1H, d, J=9. 8 Hz), 3. 64 (1H, d, J=9. 8 Hz), 3. 76 (3H, s), 5. 04 (1H, s), 7. 17~7. 50 (8H, m)



) (以上、少ない方の異性体)

IR (nujol) 3435, 1745, 1727, 1681, 1596, 1571, 1562, 1418, 1265, 1219, 1174, 1041, 850, 798, 742, 699

- 5 実施例1で示される実験を繰り返し行い、化合物 (II-1-1) を更に22.6 g得た。

実施例2 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロ  
10ール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-1) 及びメチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-3-1)

(1) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
15)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-1)

乾燥窒素気流下、実施例1で調製した化合物 (II-1-1) 2.3 g (5.3 mmol) 及びピリジン0.84 g (0.011 mol) の1, 2-ジクロロエ  
タン50 ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化チオニル1.3 g (0.011  
20 mol) を6分で滴下した (内温3~4℃)。反応混合物を氷冷下 (内温2~4℃) 1.5時間ついで室温下0.5時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣  
を酢酸エチル50 mlに溶解した。このものを氷水100 mlに加え、有機層を  
分離した。水層 (pH~3) を酢酸エチルで抽出した (30 ml×2)。抽出液  
及び先の有機層を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (20 ml×1) ついで  
25 飽和食塩水 (20 ml×1) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮し  
て粗生成物2.4 g (無色樹脂状物) を得た。このものをシリカゲルカラムクロ  
マトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、8:1, v/v) により精製し、白色固  
体1.0 gを得た。このものをヘキサントルエン混合液 (2:1, v/v)  
で洗浄し、ろ取し、減圧下乾燥して標記化合物 (化合物番号I-1-1) 0.8

4 gを白色粉末として得た。

mp 132~133°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.72, 1.74 (6H, each s),  
1.82 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 6.57 (1  
5 H, q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.17 (2H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 7.20  
~7.43 (6H, m)

IR (nujol) 1740, 1704, 1653, 1589, 1564, 1  
430, 1363, 1285, 1271, 1244, 1191, 858, 798,  
756, 723, 687, 648

10

(2) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-  
-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール  
-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-1) 及びメチル 1-(1-(3,  
5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3  
15 -フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-3-1)

乾燥窒素気流下、実施例1で調製した化合物 (II-1-1) 11.8 g (0.  
027 mol) 及びピリジン4.2 g (0.053 mol) のDMF 120 ml  
中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化チオニル5.3 g (0.044 mol) のD  
MF 3 ml 中溶液を10分で滴下した (内温3~11°C)。反応混合物を室温下7  
20 0分攪拌した。反応混合物を氷水300 ml にあけ、酢酸エチルで抽出した (1  
20 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、水 (100 ml  $\times$  1)、飽和炭酸水素ナトリウ  
ム水溶液 (80 ml  $\times$  2) ついで飽和食塩水 (100 ml  $\times$  1) で洗浄し、硫酸  
ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物13.1 g (無色樹脂状物) を得  
た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、8  
25 : 1, v/v) により精製し、得られた白色固体をヘキサンで洗浄し、ろ取し、  
減圧下乾燥して標記化合物 (化合物番号I-1-1) 8.4 g 及び (化合物番号I  
-3-1) 1.5 g を共に白色粉末として得た。

化合物番号I-3-1:

mp 117~119°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 67 (6H, s), 3. 81 (3H, s),  
4. 2~4. 5 (2H, m), 5. 36 (1H, m), 5. 52 (1H, m),  
7. 14 (2H, d,  $J=1. 8\text{Hz}$ ), 7. 20 (1H, t,  $J=1. 8\text{Hz}$   
) , 7. 2~7. 5 (5H, m)

5 IR (nujol) 1749, 1694, 1660, 1567, 1267, 1  
247, 1193, 1026, 800

実施例2で示される実験をくりかえし行い、化合物(I-1-1)を更に6.  
3 g得た。

10 実施例3 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチ  
ル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-3-(1-メチルエトキシ)-2-オキソ  
ピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-1-20)

(1) 2-(1-メチルエトキシ) マロン酸モノメチル

2-(1-メチルエトキシ) マロン酸ジメチル 2. 62 g (13. 8 mmol)  
15 ) のメタノール 15 ml 中溶液を氷冷下撹拌し、これに水酸化カリウム 0. 93  
g (14. 1 mmol) のメタノール 4 ml 中溶液を加えた。反応混合物を室温  
下一夜撹拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に氷水 30 ml を加  
えた。このものをジエチルエーテルで洗浄し (20 ml)、1 N 塩酸を加え、p  
H 3 とした。このものを酢酸エチルで抽出した (30 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、  
20 硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して 2-(1-メチルエトキシ) マロン酸  
モノメチル 0. 82 g を無色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 27 (6H, d,  $J=6. 1\text{Hz}$ ), 3.  
75~3. 96 (4H, m), 4. 61 (1H, s), 7. 24 (1H, br.  
s)

25 IR (neat) 3208, 1748, 1439, 1386, 1280, 12  
07, 1178, 1116, 1017, 931, 839, 690

(2) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
-4-ヒドロキシ-4-メチル-3-(1-メチルエトキシ)-2-オキソピロ

リジン-3-カルボキシレート（化合物番号II-1-20）

実施例3の（1）で調製した2-（1-メチルエトキシ）マロン酸モノメチル  
0.82g（4.7mmol）の1,2-ジクロロエタン6ml中溶液にDMF  
2滴を加え、氷冷下攪拌し、これに塩化オキサリル0.44ml（5.1mmol）  
5 1）を徐々に加えた。反応液を室温下40分ついで外温60℃で0.5時間攪拌  
した。冷後、反応液を減圧下濃縮し、2-クロロホルミル-2-（1-メチルエ  
トキシ）酢酸メチルの粗生成物0.94gを油状物として得た。

1-（1-（3,5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチルアミノ）-2-  
-プロパノン1.1g（4.2mmol）及びトリエチルアミン0.77ml（  
10 5.5mmol）の乾燥THF6ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに2-クロロ  
ホルミル-2-（1-メチルエトキシ）酢酸メチルの粗生成物0.94g（4.  
7mmol）の乾燥THF1ml中溶液を5分で滴下した。反応混合物を室温  
下1時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチル30mlを  
加えた。このものを1N塩酸ついで飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾  
15 燥後、減圧下濃縮して標記化合物の粗生成物（化合物番号II-1-20）1.9  
2gを油状物として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であつ  
た（異性体比は<sup>1</sup>H-NMRから2:1）。

<sup>1</sup>H-NMR（CDCl<sub>3</sub>）δ 1.08~1.90（15H, m）, 3.29  
~3.58（2H, m）, 3.85（3H, s）, 4.10~4.36（1H,  
20 m）, 7.12~7.36（3H, m）（以上、多い方の異性体）；1.08~  
1.90（15H, m）, 3.29~3.58（2H, m）, 3.83（3H,  
s）, 4.46~4.66（1H, m）, 7.12~7.36（3H, m）（以  
上、少ない方の異性体）

25 実施例4 メチル 1-（1-（3,5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチ  
ル）-1,3-ジヒドロ-4-メチル-3-（1-メチルエトキシ）-2-オキ  
ソ-2H-ピロール-3-カルボキシレート（化合物番号I-1-30）及びメ  
チル 1-（1-（3,5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチル）-4-メ  
チレン-3-（1-メチルエトキシ）-2-オキソピロリジン-3-カルボキシ

レート (化合物番号I-3-6)

乾燥窒素気流下、実施例3で調製した化合物 (II-1-20) の粗生成物 1.9 g (4.2 mmol) 及びピリジン 1.0 ml (0.012 mol) の 1, 2-ジクロロエタン 12 ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化チオニル 0.45 ml (6.3 mmol) の 1, 2-ジクロロエタン 1 ml 中溶液を 10 分で滴下した。反応混合物を室温下一夜攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に酢酸エチル 40 ml 加えた。このものを水ついで飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、3:1、v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号I-1-30) 0.36 g 及び (化合物番号I-3-6) 0.19 g を共に黄色樹脂状物として得た。

化合物番号I-1-30:

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.20 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.22 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.69 (3H, s), 1.73 (3H, d,  $J=1.7\text{ Hz}$ ), 1.80 (3H, s), 3.73~3.94 (4H, m), 6.49 (1H, q,  $J=1.7\text{ Hz}$ ), 7.21 (2H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ ), 7.24 (1H, t,  $J=1.9\text{ Hz}$ )

IR ( $\text{CHCl}_3$ ) 1760, 1715, 1589, 1567, 1434, 1417, 1385, 1368, 1268, 1238, 1181, 1110, 858, 798, 757, 690

化合物番号I-3-6:

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.17 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ) 1.26 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.67 (3H, s), 1.76 (3H, s), 3.75~3.91 (4H, m), 4.20~4.28 (2H, m), 5.38~5.43 (1H, m), 5.54~5.60 (1H, m), 7.18~7.26 (3H, m)

IR ( $\text{CHCl}_3$ ) 1762, 1706, 1588, 1566, 1434, 1417, 1384, 1250, 1182, 1112, 1062, 921, 857, 798, 756, 690

実施例5 メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-2-1)

- 5 (1) N-(2,5-ジクロロフェニル)-2-メチル-2-(2-オキソプロピルアミノ)プロパンアミド

2-アミノ-N-(2,5-ジクロロフェニル)-2-メチルプロパンアミド 21.2 g (0.086 mol)、炭酸カリウム 14.1 g (0.10 mol)、ヨウ化カリウム 1.0 g (6.0 mmol) 及び乾燥 DMF 85 ml の混合物を  
10 氷冷下撹拌し、これにクロロアセトン 33.4 g (0.34 mol) を 13 分で滴下した。反応混合物を室温下 52 時間撹拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に氷水 100 ml を加え、酢酸エチルで抽出した (50 ml, 30 ml × 2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し (30 ml × 2)、減圧下濃縮した。得られた残渣を 1N 塩酸 86 ml (0.086 mol) と混合し (pH ~ 1)、ジ  
15 エチルエーテルで洗浄 (20 ml × 3) 後、水酸化ナトリウム水溶液 (93% 水酸化ナトリウム 3.7 g (0.086 mol) / 水 20 ml) で中和した (pH 7 ~ 8)。このものを酢酸エチルで抽出した (50 ml, 30 ml × 2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄 (20 ml × 2)、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物 15.9 g (赤褐色透明油状物) を得た。このものをシリカ  
20 ゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、8:1 → 6:1 → 5:1, v/v) により精製し、N-(2,5-ジクロロフェニル)-2-メチル-2-(2-オキソプロピルアミノ)プロパンアミド 6.8 g を淡黄色透明油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.40 (6H, s), 2.18 (3H, s),  
25 3.56 (2H, s), 7.00 (1H, dd,  $J=8.6, 2.5\text{ Hz}$ ), 7.28 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8.52 (1H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ ), 9.94 ~ 10.25 (1H, m)

IR (neat) 3282, 3113, 2977, 2933, 1723, 1699, 1586, 1574, 1511, 1445, 1409, 1362, 117

1, 1145, 1091, 1046, 804

(2) メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-2-1)

実施例5の(1)で調製したN-(2,5-ジクロロフェニル)-2-メチル-2-(2-オキソプロピルアミノ)プロパンアミド2.5g (8.2mmol) 及びトリエチルアミン1.1g (0.011mol) の乾燥THF 20ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物2.3g (0.010mol) の乾燥THF 20ml 中溶液を6分で滴下した。反応混合物を室温下46.5時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に氷水30mlを加え、酢酸エチルで抽出した (30ml, 20ml×2)。抽出液を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (20ml×1) ついで飽和食塩水 (20ml×1) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物5.0g (淡黄色樹脂状固体) を得た。このものをジエチルエーテルで洗浄し、粉碎した。不溶の固体をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄 (×2)、風乾して標記化合物 (化合物番号II-2-1) 2.9g を白色粉末として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった (異性体比は<sup>1</sup>H-NMRから50:50)。

mp 106~120℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.43 (1H, d, J=2.1Hz), 1.55 (3H, s), 1.66 (6H, s), 3.58 (1H, d, J=9.5Hz), 3.71 (3H, s), 3.85 (1H, dd, J=2.3, 9.5Hz), 6.95~7.10 (1H, m), 7.19~7.59 (6H, m), 8.53 (1H, d, J=2.4Hz), 8.57 (1H, br. s) (以上一方の異性体); 1.19 (3H, s), 1.66 (3H, s), 1.81 (3H, s), 3.33 (1H, dd, J=1.8, 9.8Hz), 3.54 (1H, d, J=9.7Hz), 3.77 (3H, s), 5.02 (1H, d, J=1.7Hz), 6.95~7.10 (1H, m), 7.19~7.59 (6H, m), 8.

3.9 (1H, d, J=2.3 Hz), 8.57 (1H, br. s) (以上他方の異性体)

IR (nujol) 3373, 1759, 1746, 1707, 1674, 1585, 1509, 1464, 1407, 1260, 1214, 1144

5

実施例6 メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-2-1) 及び  
10 メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-4-1)

乾燥窒素気流下、実施例5で調製した化合物 (II-2-1) 2.9 g (6.0 mmol) のピリジン 7 ml (0.087 mol) 中溶液を寒剤 (氷水、食塩) で冷却下撹拌し、これに塩化チオニル 13 ml (0.18 mol) を 25 分で  
15 滴下した (内温 -2 ~ 0 °C)。反応混合物を内温 -3 ~ 0 °C で 1 時間撹拌した。反応混合物を氷 150 ml に徐々に滴下した。析出した固体をろ取り、水洗 (×2) 後、酢酸エチル 50 ml に溶解した。この溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (20 ml × 2) ついで飽和食塩水 (20 ml × 2) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物 2.9 g (淡黄色樹脂状物) を得た。こ  
20 のものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル, 3 : 1 → 2 : 1, v/v) により精製し、淡褐色樹脂状物 (A) 0.25 g 及び (B) 0.30 g を得た。(A) をジイソプロピルエーテルと混合し、析出した固体をろ取り、ジイソプロピルエーテルで洗浄 (×3)、風乾して標記化合物 (化合物番号 I-2-1) 0.08 g を白色粉末として得た。一方、(B) を再度シリカゲル  
25 カラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル, 5 : 1, v/v) により精製し、白色固体 0.12 g を得た。このものをジエチルエーテルで洗浄し、ろ取り、風乾して標記化合物 (化合物番号 I-4-1) 0.09 g を白色粉末として得た。

化合物番号 I-2-1 : mp 157 ~ 159 °C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67 (3H, s), 1.74 (3H, s),



1. 86 (3H, d,  $J=1.5$  Hz), 3. 76 (3H, s), 6. 66 (1H, q,  $J=1.6$  Hz), 6. 99 (1H, dd,  $J=2.5, 8.6$  Hz), 7. 16~7. 48 (6H, m), 8. 27 (1H, br. s), 8. 37 (1H, d,  $J=2.4$  Hz)

5 IR (nujol) 3363, 1724, 1698, 1576, 1511, 1406, 1362, 1284, 1249, 1142, 1093

化合物番号I-4-1: mp 164~165°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 59 (3H, s), 1. 68 (3H, s), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (1H, dt,  $J=13.4, 2.2$  Hz), 4. 36 (1H, dt,  $J=13.3, 2.0$  Hz), 5. 42 (1H, t,  $J=2.0$  Hz), 5. 59 (1H, br. s), 6. 98 (1H, dd,  $J=2.5, 8.6$  Hz), 7. 21 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7. 27~7. 56 (5H, m), 8. 33 (1H, br. s), 8. 40 (1H, d,  $J=2.5$  Hz)

15 IR (nujol) 3352, 1721, 1697, 1660, 1576, 1511, 1463, 1407, 1259, 1244, 1148, 1093, 930, 816, 694

実施例7 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ホルミル-1, 3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-13)

実施例2で調製した化合物 (I-1-1) 6. 97 g (0. 0166 mol) のジオキサン280 ml 中溶液に二酸化セレン4. 51 g (0. 039 mol) を加えた。反応混合物を加熱還流下9時間、室温下14時間、加熱還流下10時間ついで室温下14時間攪拌した。反応混合物をろ過して不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。得られた残渣に水80 ml を加え、酢酸エチルで抽出した (80 ml  $\times$  3)。抽出液を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (50 ml  $\times$  2) ついで飽和食塩水で洗浄し (60 ml)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物8. 10 gを得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラ

フィ（ヘキサン-酢酸エチル、2：1、v/v）により精製し、得られた固体をヘキサン-ジイソプロピルエーテル混合液（5：1、v/v）で洗浄し、ろ取し、減圧下乾燥して標記化合物3.91gを白色結晶として得た。

mp 167~169℃

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.82 (3H, s), 1.84 (3H, s), 3.79 (3H, s), 7.12 (2H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 7.27~7.37 (6H, m), 7.91 (1H, s), 9.59 (1H, s)

IR (nujol) 1757, 1730, 1658, 1604, 1257, 1180, 799

10 実施例7で示される実験を繰り返し行い、化合物(I-1-13)を更に2.2g得た。

実施例8 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-ヒドロキシミノメチル-2-オキソ-3-フェ  
15 ニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-14)

実施例7で調製した化合物(I-1-13) 0.52g (1.2mmol)のメタノール10ml中溶液にヒドロキシルアミン塩酸塩0.11g (1.6mmol)及びピリジン0.12g (1.6mmol)を加え、室温下2時間20分  
20 攪拌した。反応混合物に更にヒドロキシルアミン塩酸塩0.035g (0.47mmol)及びピリジン0.036g (0.46mmol)を加え、室温下2時間40分攪拌した。反応混合物を氷水にあげ、析出した固体をろ取し、水ついでヘキサンで洗浄後、減圧下乾燥して標記化合物0.53gを白色結晶として得た。このものは2種類の幾何異性体の混合物であった(異性体比は $^1\text{H-NMR}$ から71:29)。

25 mp 85~88℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  1.68 (6H, s), 3.69 (3H, s), 7.24~7.46 (8H, m), 7.79 (1H, s), 7.94 (1H, s), 10.96 (1H, s) (以上、多い方の異性体); 1.68 (6H, s), 3.74 (3H, s), 6.84 (1H, s), 7.24~7.46 (8

H, m), 8.28 (1H, s), 11.72 (1H, s) (以上、少ない方の異性体)

IR (nujol) 3385, 1750, 1718, 1589, 1567, 1274, 1182

5

実施例9 メチル 4-アセトキシイミノメチルー1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニルー2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-16)

実施例8で調製した化合物 (I-1-14) 0.40 g (0.90 mmol) 及びピリジン 0.075 g (1.0 mmol) の乾燥 THF 20 ml 中溶液を氷冷下撹拌し、これに塩化アセチル 0.092 g (1.2 mmol) の乾燥 THF 4 ml 中溶液を5分で滴下した。反応混合物を室温下7時間20分撹拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水 30 ml を加え、酢酸エチルで抽出した (30 ml × 3)。抽出液を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (30 ml)、ついで飽和食塩水で洗浄し (30 ml)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物 0.48 g を得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、2:1, v/v) により精製した。得られた固体をヘキサンで洗浄し、ろ取し、減圧下乾燥して標記化合物 0.24 g を白色結晶として得た。このものは<sup>1</sup>H-NMRから単一の異性体であると考えられた。

mp 136~138℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.77 (6H, s), 2.11 (3H, s), 3.84 (3H, s), 7.11 (2H, d, J=1.8 Hz), 7.23~7.25 (1H, m), 7.35 (5H, s), 7.69 (1H, s), 8.00 (1H, s).

IR (nujol) 1755, 1725, 1615, 1565, 1266, 1182, 1001, 943

実施例10 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシ

レート（化合物番号I-3-1）

（1）メチル 2-ブロモ-N-（1-（3, 5-ジクロロフェニル）-1-メチルエチル）-2-フェニル-N-（2-プロピニル）マロナメート（化合物番号III-2-1）

- 5 実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物1.1g（5.2mmol）の1, 2-ジクロロエタン10ml中溶液を外温70℃で加熱攪拌し、これに臭素0.87g（5.4mmol）の1, 2-ジクロロエタン5ml中溶液を10分で滴下した。反応混合物を還流下3時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物を減圧下濃縮し、2-ブロモ-2-フェニル  
10 マロン酸モノメチルの酸ハロゲン化物の粗生成物1.7gを黄色油状物として得た。

- 参考例1で調製した化合物（IV-3-1）1.2g（5.0mmol）及びトリエチルアミン0.6g（6.0mmol）のジクロロメタン5ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに2-ブロモ-2-フェニルマロン酸モノメチルの酸ハロゲン  
15 化物の粗生成物1.7gのジクロロメタン5ml中溶液を0.5時間で滴下した。反応混合物を室温下6時間攪拌した。反応混合物を水にあげ、ジクロロメタンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ヘキサン-酢酸エチル、9：1→2：1、v/v）により精製し、標記化合物（化合物番号III-2-1）0.2gを白色  
20 結晶として得た。

mp 165~166℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.77, 1.80 (6H, each s),  
2.30 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.9~4.3 (2H, m),  
7.2~7.7 (8H, m)

- 25 IR (nujol) 3242, 2113, 1753, 1672, 1242, 1199

参考例1及び実施例10の（1）で示される実験をくりかえし行い、化合物（III-2-1）を更に0.2g得た。

(2) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-3-1)

実施例10の(1)で調製した化合物(III-2-1) 0.4 g (0.8 mmol) の乾燥ベンゼン10 ml 中溶液を外温80℃で加熱攪拌し、これに水素化トリブチルスズ0.3 g (1.0 mmol) 及び触媒量のAIBNの乾燥ベンゼン5 ml 中溶液を2時間で滴下した。反応混合物を同温で2時間攪拌した後、更に水素化トリブチルスズ0.3 g (1.0 mmol) 及び触媒量のAIBNの乾燥ベンゼン5 ml 中溶液を0.5時間で滴下した。反応混合物を更に同温で2時間攪拌した。冷後、反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、9:1→2:1, v/v)により精製し、標記化合物(化合物番号I-3-1) 0.1 gを白色結晶として得た。

実施例11 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-31)

(1) メチル N-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-N-(エトキシカルボニルメチル)-2-フェニルマロナメート (化合物番号III-3-1)

エチル 2-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)アセテート3.38 g (11.7 mmol) 及びトリエチルアミン2.1 ml (15.1 mmol) のTHF 20 ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物3.06 g (14.0 mmol) のTHF 4 ml 中溶液を0.5時間で滴下した。反応混合物を室温下1時間攪拌した。反応混合物に水20 mlを加え、有機層を分離し、水層を酢酸エチルで抽出した(20 ml)。抽出液及び先の有機層を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、2:1, v/v)により精製し、標記化合物(化合物番号III-3-1) 4.95 gを淡

黄色樹脂状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.34 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.38 (3H, s), 1.65 (3H, s), 3.70 (3H, s), 4.10~4.40 (4H, m), 4.67 (1H, s), 7.10~7.53 (8H, m)

IR ( $\text{CHCl}_3$ ) 1749, 1662, 1588, 1567, 1434, 1417, 1389, 1260, 1207, 1167, 1025, 912, 855, 797, 732

- 10 (2) メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-31)

実施例11の(1)で調製した化合物(III-3-1) 4.95 g (10.6 mmol) のメタノール10ml中溶液を氷冷下攪拌し、これにナトリウムメトキシドの28%メタノール溶液2.7 g (ナトリウムメトキシド14.0 mmol) を加えた。反応混合物を室温下1時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に氷水80mlを加えた。このものをジエチルエーテルで洗浄し(50ml $\times$ 2)、塩酸を加えてpHを3とした。析出した固体をろ取し、水洗し、風乾して標記化合物(化合物番号I-1-31) 4.13 gを無色結晶として得た。

mp 176~180°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.64 (6H, s), 3.88 (3H, s), 4.81 (1H, s), 7.05~7.46 (6H, m), 7.60~7.70 (2H, m)

25 IR (nujol) 1747, 1634

実施例12 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メトキシ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-32)

実施例11で調製した化合物(I-1-31) 1.0 g (2.4 mmol)、炭酸カリウム0.49 g (3.6 mmol) 及びDMF 6 mlの混合物にp-トルエンスルホン酸メチル0.53 g (2.9 mmol)を加え、外温50℃で一  
夜攪拌した。冷後、反応混合物に氷水20 mlを加え、酢酸エチルで抽出した(20 ml×2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥  
5 後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィにより2回くりかえし精製した(1回目、ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v; 2  
回目、ヘキサングエチルエーテル、1:1、v/v)。得られた樹脂状物にヘキサンを加えて結晶化させ、ろ取し、風乾して標記化合物0.62 gを白色結晶  
10 として得た。

mp 141~143℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.65 (3H, s), 1.69 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.86 (3H, s), 4.92 (1H, s), 7.20 (1H, t, J=1.9 Hz), 7.27~7.57 (7H, m)

15 IR (nujol) 1754, 1698, 1667, 1563, 1455, 1343, 1268, 1210, 1165, 994, 952, 863, 796, 738

実施例13 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-ヒドロキシメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-19)

20

実施例7で調製した化合物(I-1-13) 0.48 g (1.1 mmol) 及び塩化セリウム・7水和物0.42 g (1.1 mmol)のメタノール10 ml中溶液に水素化ホウ素ナトリウム0.050 g (1.1 mmol)を5分で加え、  
25 室温下1時間攪拌した。反応混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液100 mlにあけ、クロロホルムで抽出した(60 ml×3)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し(60 ml)、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物0.48 gを得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v)により精製し、標記化合物0.17 gを白色結晶として

得た。

mp 152~154℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.76 (6H, s), 1.92~2.08 (1H, m), 3.86 (3H, s), 4.31 (2H, s), 6.92 (1H, s), 7.17 (2H, d, J=1.8 Hz), 7.22~7.26 (3H, m), 7.32~7.38 (3H, m)

IR (nujol) 3455, 1750, 1693, 1568, 1248, 1176, 1020, 694

実施例13で示される実験をくりかえし行い、化合物(I-1-19)を更に0.6g得た。

実施例14 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-メトキシメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-20)

実施例13で調製した化合物(I-1-19) 0.43g (1.0mmol) のアセトニトリル4ml中溶液を室温下攪拌し、これに酸化銀0.35g (1.5mmol) 及びヨウ化メチル4.54g (0.032mol) を加えた。反応混合物を還流下1.5時間加熱攪拌した。反応混合物に更にヨウ化メチル2.27g (0.016mol) を加え、更に5時間同温で加熱攪拌した。冷後、不溶の固体をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v)、ついで分取シリカゲル薄層クロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v) により精製した。得られた固体をヘキサングエチルエーテル混合溶媒で洗浄し、ろ取し、減圧下乾燥させて標記化合物0.11gを淡褐色結晶として得た。

mp 94~97℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.75 (6H, s), 3.34 (3H, s), 3.83 (3H, s), 4.05 (2H, d, J=1.3 Hz), 6.91 (1H, br. s), 7.17 (2H, d, J=1.8 Hz), 7.21~7.34 (6H, m)



IR (nujol) 1740, 1713, 1589, 1565, 1178, 1078, 859, 797

5 実施例15 メチル 4-アセトキシメチル-1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-21)

実施例13で調製した化合物(I-1-19) 0.24g (0.55mmol) 及び4-ジメチルアミノピリジン0.013g (0.10mmol) のジクロロメタン5ml中溶液を氷冷下撹拌し、これに無水酢酸0.072g (0.70mmol) のジクロロメタン3ml中溶液を3分で滴下した。反応混合物を室温下1時間撹拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水40mlを加え、酢酸エチルで抽出した(40ml×3)。抽出液を合し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(30ml×2)、ついで飽和食塩水で洗浄し(50ml)、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物0.30gを得た。このものをシリカゲル  
10 カラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、4:1、v/v)により精製し、標記化合物0.21gを無色樹脂状物として得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.75, 1.76 (6H, each s), 2.01 (3H, s), 3.84 (3H, s), 4.66 (1H, d, J=13.2Hz), 4.86 (1H, d, J=13.2Hz), 7.02 (1H, s),  
20 7.15 (2H, d, J=1.8Hz), 7.22~7.28 (3H, m), 7.32~7.37 (3H, m)

IR (neat) 1748~1715, 1652, 1588, 1567, 1235, 1022, 797

25 実施例16 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-エテニル-1, 3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-18)

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド0.31g (0.87mmol) のTHF 8ml中懸濁液を氷冷下撹拌し、これにn-ブチルリチウムのヘキサン溶液

(1.55M) 0.56ml (0.87mmol) を加え、室温下0.5時間攪拌した。反応混合物を内温-65℃に冷却下攪拌し、これに実施例7で調製した化合物(1-1-13) 0.30g (0.69mmol) を徐々に加えた。反応混合物を同温で15分ついで室温下0.5時間攪拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィで2回精製し(1回目、ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v、2回目、ヘキサン-酢酸エチル、4:1、v/v)、得られた固体を冷ヘキサンで洗浄し、ろ取し、風乾して標記化合物0.07gを無色結晶として得た。

mp 88~90℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.72 (6H, s), 3.83 (3H, s), 4.90~5.05 (2H, m), 6.40 (1H, dd, J=17.3, 11.6 Hz), 6.92 (1H, s), 7.15 (2H, d, J=1.8 Hz), 7.22 (1H, t, J=1.8 Hz), 7.29~7.49 (5H, m)

IR (nujol) 1759, 1711, 1458, 1265, 1231, 1192, 1140, 852, 690

実施例17 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピペリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-3-1)

(1) メチル N-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-N-(3-オキソブチル)-2-フェニルマロナメート (化合物番号III-1-1)

1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-3-ブタノン1.4g (5.2mmol) 及びトリエチルアミン0.55g (5.4mmol) の1,2-ジクロロエタン20ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物1.1g (5.2mmol) の1,2-ジクロロエタン5ml中溶液を滴下した。反応混合物を室温下一夜攪拌した。反応混合物を水にあげ、1,2-ジクロロエタンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（クロロホルム－酢酸エチル、2 : 1、v / v）により精製し、標記化合物（化合物番号III-1-1）1. 1 gを白色結晶として得た。

mp 131 ~ 132 °C

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 50, 1. 67 (6H, each s), 2. 15 (3H, s), 2. 4 ~ 2. 9 (2H, m), 3. 67 (3H, s), 3. 7 ~ 3. 9 (2H, m), 4. 79 (1H, s), 6. 98 (2H, d,  $J = 1. 8 \text{ Hz}$ ), 7. 17 (1H, t,  $J = 1. 8 \text{ Hz}$ ), 7. 2 ~ 7. 5 (5H, m)

10 IR (nujol) 1750, 1711, 1649, 1563, 1208, 1165, 1155, 1013, 857, 793, 722

(2) メチル 1- (1- (3, 5-ジクロロフェニル) -1-メチルエチル) -4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニルピペリジン-3-カルボキシレート（化合物番号II-3-1）

15

実施例17の(1)で調製した化合物(III-1-1) 1. 0 g (2. 0 mmol) 及びトリプロピルアミン1. 7 g (12. 0 mmol) の1, 2-ジクロロエタン30 ml 中溶液を室温下攪拌し、これに四塩化チタンのジクロロメタン溶液(1. 0 M) 2. 0 ml (2. 0 mmol) を滴下した。反応混合物を室温下0. 5時間攪拌した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、セライトを用いてろ過した。ろ液を1, 2-ジクロロエタンで抽出し、抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣(固体)をヘキサーン-ジエチルエーテル混合溶媒で洗浄し、ろ取し、風乾して標記化合物(化合物番号II-3-1) 0. 45 gを白色結晶として得た。このものは $^1\text{H-NMR}$ から単一のジアステレオマーであった。

25

mp 160 ~ 162 °C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1. 34 (3H, s), 1. 64 (3H, s), 1. 82 (3H, s), 1. 7 ~ 2. 0 (2H, m), 3. 3 ~ 3. 6 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 5. 47 (1H, s), 7. 1 ~ 7. 3 (8H,

m)

IR (nujol) 3481, 1702, 1640

- 実施例18 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエ  
5 チル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニ  
ルピリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-5-1) 及びメチル 1-  
(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2  
-オキソ-3-フェニルピペリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-6  
-1)
- 10 実施例17で調製した化合物 (II-3-1) 0.1g (0.2mmol) 及び  
ピリジン0.033ml (0.4mmol) の1, 2-ジクロロエタン2ml中  
溶液を室温下攪拌し、これに塩化チオニル0.036ml (0.3mmol) を  
滴下した。反応混合物を室温下1時間攪拌した後、水を加え、1, 2-ジクロ  
15 エタンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得ら  
れた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、2:1、  
v/v) により精製し、標記化合物0.04gを白色結晶として得た。このもの  
は<sup>1</sup>H-NMRから化合物 (I-5-1) 及び (I-6-1) の5:1の混合物で  
あった。

mp 131~153°C

- 20 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.44 (3H, s), 1.64 (3H, s),  
1.73 (3H, d, J=1.5Hz), 3.76 (3H, s), 4.0~4.  
3 (2H, m), 6.0~6.1 (1H, m), 6.82 (2H, d, J=1.  
9Hz), 7.07 (1H, t, J=1.9Hz), 7.3~7.4 (5H, m  
) (以上化合物 (I-5-1)) ; 1.59 (3H, s), 1.66 (3H, s  
25 ), 2.6~2.7 (2H, m), 3.4~3.6 (2H, m), 3.72 (3  
H, s), 4.93 (1H, br. s), 5.32 (1H, br. s), 7.1  
~7.4 (8H, m) (以上化合物 (I-6-1))

IR (nujol) 1745, 1649

実施例19 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロ-4-メチルスルフィニルフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-25)

- 5 実施例2と同様の方法により調製したメチル 1-(1-(3, 5-ジクロロ-4-メチルチオフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-24) 0.12 g (0.26 mmol) のクロロホルム30 ml 中溶液を冷却下撹拌し (内温-10℃)、これにメタクロロ過安息香酸 (70  
10 %) 0.064 g (0.26 mmol) を加え、内温-11~-4℃で1.5時間撹拌した。反応混合物に亜硫酸水素ナトリウム0.06 g 及び水6 ml を加え、内温0℃で10分撹拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液12 ml 及び水6 ml を加えた。有機層を分離し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物0.19 g を得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ (クロロホルム-ヘキサン-アセトン、1:2:1、v/v) により精製し、  
15 標記化合物0.10 g を白色ロウ状固体として得た。このものは<sup>1</sup>H-NMR から2種類のジアステレオマーの混合物であった。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.72 (6H, s), 1.85 (3H, d, J=1.6 Hz), 3.04, 3.05 (3H, each s), 3.85, 3.  
20 86 (3H, each s), 6.60~6.70 (1H, m), 7.21~7.38 (7H, m)

IR (nujol) 1741, 1705, 1582, 1239, 1204, 1078, 796, 722

- 25 実施例20 メチル 4-シアノ-1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-17)

実施例7で調製した化合物 (I-1-13) 1.0 g (2.3 mmol) の DMF 7 ml 中溶液にヒドロキシルアミン塩酸塩0.20 g (2.9 mmol)

を加え、外温80℃で5時間加熱撹拌した（反応混合物中に実施例8で調製した化合物(I-1-14)を生成させた）。冷後、反応混合物に氷冷下オキシ塩化リン0.71g(4.6mmol)を加え、室温下1時間撹拌した。反応混合物を氷水にあげ、析出した結晶をろ取し、水洗、風乾後、標記化合物0.73gを  
5 白色結晶として得た。

mp 152~153℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.79 (6H, s), 3.87 (3H, s),  
7.10 (2H, d, J=1.8Hz), 7.28 (1H, t, J=1.8Hz)  
, 7.40 (5H, s), 7.69 (1H, s)

10 IR (nujol) 2213, 1758, 1730, 1610, 1464, 1369, 1270, 1243, 1208, 1179, 1008, 864, 796, 755

実施例21 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエ  
15 チル)-4-ジフルオロメチル-1,3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル  
-2H-ピロール-3-カルボキシレート（化合物番号I-1-28）

実施例7で調製した化合物(I-1-13) 2.0g(4.6mmol)、  
ジエチルアミノスルファートリフルオリド2.3g(0.014mol)及びト  
ルエン20mlの混合物を外温90℃で3時間加熱撹拌した。冷後、反応混合物  
20 に水を加え、酢酸エチルで抽出した(2回)。抽出液を合し、硫酸ナトリウムで  
乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（  
ヘキサン-酢酸エチル、4:1、v/v）により精製し、標記化合物1.2gを  
白色結晶として得た。

mp 119~120℃

25 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.77 (6H, s), 3.85 (3H, s),  
6.34 (1H, ddd, J=56.5, 54.6, 0.9Hz), 7.13 (  
2H, d, J=1.8Hz), 7.23~7.39 (7H, m)

IR (nujol) 1752, 1717, 1651, 1463, 1273, 1239, 1194, 1076, 1046, 1010, 860, 802, 756,

713

実施例22 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号II-1-22)

参考例5で調製した化合物(IV-1-5) 3.0g (9.8mmol) 及びトリエチルアミン1.5g (0.015mol) の乾燥THF 40ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物2.5g (0.012mol) の乾燥THF 5ml 中溶液を滴下した。反応混合物を室温下2時間攪拌した。反応混合物を氷水にあけ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、1:1、v/v)により精製し、標記化合物2.8gを無色透明油状物として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった(異性体比は<sup>1</sup>H-NMRから2:1)。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67 (3H, s), 1.84 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.23 (1H, d, J=13.8Hz), 2.50 (1H, d, J=13.7Hz), 3.60~3.82 (5H, m), 5.19 (1H, s), 7.20~7.37 (8H, m) (以上、多い方の異性体); 1.57 (3H, s), 1.75 (3H, s), 2.17 (3H, s), 2.90 (1H, d, J=12.0Hz), 3.43 (1H, d, J=12.5Hz), 3.62~3.80 (5H, m), 5.16 (1H, s), 7.15~7.38 (8H, m) (以上、少ない方の異性体)

実施例23 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-35) 及びメチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-メチルチオメチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート

(化合物番号I-3-7)

実施例22で調製した化合物(II-1-22) 1.8 g (3.7 mmol)、  
トリフェニルホスフィン 3.6 g (0.014 mol) 及び四塩化炭素 1.1 ml  
(0.011 mol) のアセトニトリル 35 ml 中溶液を還流下 1.5 時間加  
5 熱攪拌した。反応混合物を氷水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和  
食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣にヘ  
キサン-酢酸エチル混合液 (1:1, v/v) を加え、不溶の固体をろ取した。  
ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキ  
10 サン-酢酸エチル, 2:1, v/v) により精製し、油状物 1.7 g を得た。こ  
のものにヘキサン-酢酸エチル混合液 (1:1, v/v) を加え、析出した固体  
をろ取し、風乾して標記化合物 (化合物番号I-1-35) 0.56 g を白色結  
晶として得た。ろ液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト  
グラフィ (ヘキサン-酢酸エチル, 5:1, v/v) により精製し、標記化合物  
(化合物番号I-3-7) 0.54 g を白色結晶として得た。

15 化合物番号I-1-35: mp 154~156°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.74, 1.77 (6H, each s),  
2.08 (3H, s), 3.22 (1H, dd,  $J=15.2, 1.6\text{ Hz}$ ),  
3.36 (1H, dd,  $J=15.2, 1.2\text{ Hz}$ ), 3.83 (3H, s),  
6.80 (1H, t,  $J=1.3\text{ Hz}$ ), 7.12~7.45 (8H, m)

20 化合物番号I-3-1: mp 107~109°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.66, 1.68 (6H, each s),  
2.38 (3H, s), 3.83 (3H, s), 4.20~4.27 (2H, m),  
6.24 (1H, m), 7.15~7.45 (8H, m) (このものは二重  
結合に関する立体配置 (E/Z) は不明であるが、単一の異性体であると考えら  
25 れる。)

実施例24 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエ  
チル)-1,3-ジヒドロ-4-メチルスルホニルメチル-2-オキソ-3-フ  
ェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-37)



実施例23で調製した化合物(I-1-35) 0.1g (0.21mmol) のジクロロメタン5ml中溶液を氷冷下攪拌し、これにメタクロロ過安息香酸(70%) 0.11g (0.52mmol)を徐々に加えた。反応混合物を室温下2時間攪拌した。反応混合物を5%亜硫酸ナトリウム水溶液ついで飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣にヘキサージエチルエーテル混合液を加え、不溶の固体をろ取り、風乾して標記化合物0.09gを白色結晶として得た。

mp 185~187°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.78 (6H, s), 2.78 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.90~4.00 (2H, m), 7.10~7.45 (9H, m)

IR (nujol) 1750, 1718, 1464, 1312, 1121

実施例25 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-3-(2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-2-オキソピロリジン-3-カルボキシレート(化合物番号II-1-24)

参考例8で調製した化合物(V'-1-1) 3.3g (0.016mol)の1,2-ジクロロエタン12ml中溶液に氷冷下、塩化チオニル1.3ml (0.017mol)を加え、外温70°Cで1時間ついで還流下2時間加熱攪拌した。冷後、反応液を減圧下濃縮し、2-クロロホルミル-2-(2-フルオロフェニル)酢酸メチルの粗生成物3.6gを得た。1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン4.1g (0.016mol)及びトリエチルアミン2.9ml (0.021mol)の乾燥THF30ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに上記の粗生成物3.6g (0.016mol)を15分で滴下した。反応混合物を室温下3日間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した(3回)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣にジエチルエーテルを加え、析出した固体をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄、風乾して標記化合物3.5gを白色結晶として得た。このものは2種類

のジアステレオマーの混合物であった（異性体比は $^1\text{H}$ -NMRから3:2）。

mp 200~204°C (dec.)

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.26 (1H, br. s), 1.61~1.62 (3H, m), 1.63 (3H, s), 1.74 (3H, s), 3.53 (1H, d,  $J=9.6\text{ Hz}$ ), 3.71 (3H, s), 4.17 (1H, d,  $J=9.6\text{ Hz}$ ), 7.03~7.50 (7H, m) (以上、多い方の異性体); 1.10~1.20 (3H, m), 1.65 (3H, s), 1.84 (3H, s), 3.35 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 3.72 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 3.77 (3H, s), 5.42 (1H, br. s), 7.03~7.50 (7H, m) (以上、少ない方の異性体)

IR (nujol) 3428, 3402, 1726, 1713, 1697, 1680, 1376, 1258, 759

実施例26 メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-3-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-2-オキソ-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-1-39) 及びメチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-3-(2-フルオロフェニル)-4-メチレン-2-オキソピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-3-10)

実施例25で調製した化合物 (II-1-24) 2.5 g (7.6 mmol) 及びピリジン 1.2 ml (0.015 mol) のDMF 32 ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化チオニル 0.88 ml (0.012 mol) を20分で滴下した。反応混合物を室温下3時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した (3回)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、5:1または7:1、v/v) 及びシリカゲル薄層クロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、5:1、v/v) により繰り返し精製し、標記化合物 (化合物番号I-1-39) 2.0 g 及び (化合物番号I-3-10) 0.29 g を共に白色結晶として得た。

化合物番号I-1-39: mp 117~118℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.74, 1.76 (6H, each s),  
1.81 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 6.53 (1  
H, br. q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.02~7.36 (7H, m)

5 IR (nujol) 1759, 1743, 1721, 1702, 1692, 1  
588, 1567, 1492, 1455, 1435, 1417, 1380, 13  
66, 1272, 1245, 1220, 1197, 1182, 1114, 109  
6, 1000, 858, 799, 761, 749

化合物番号I-3-10: mp 146~147℃

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.69, 1.74 (6H, each s),  
3.85 (3H, s), 4.27 (1H, dt,  $J=13.5, 2.2\text{ Hz}$ ),  
4.45 (1H, dt,  $J=13.5, 2.2\text{ Hz}$ ), 5.30 (1H, br.  
s), 5.39 (1H, br. s), 7.01~7.41 (7H, m)

15 IR (nujol) 1729, 1700, 1672, 1588, 1567, 1  
491, 1459, 1417, 1379, 1251, 1234, 1216, 10  
51, 919, 853, 815, 799, 756

実施例27 2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシカルボニル-4-メチル-2  
-オキソ-3-フェニルピロリジン-1-イル)-2-メチルプロパン酸ベンジ  
20 ル (化合物番号II'-2-1)

2-メチル-2-(2-オキソプロピルアミノ)プロパン酸ベンジル 14.6  
g (0.059 mol) 及びトリエチルアミン 9.0 g (0.089 mol) の  
乾燥THF 280 ml 中溶液をドライアイス及びアセトンの混合物にて冷却下攪  
拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル  
25 酢酸メチルの粗生成物 14.3 g (0.064 mol) の乾燥THF 40 ml 中  
溶液を23分で滴下した (内温 -44→-30℃)。反応混合物を攪拌しながら  
徐々に室温まで昇温させ、ついで室温下攪拌した (攪拌時間計 66.5時間)。  
反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に氷水 100 ml を加え、酢酸エチルで抽出し  
た (50 ml, 30 ml × 2)。抽出液を合し、0.3N塩酸 (40 ml)、飽

和炭酸水素ナトリウム水溶液 (30 ml) ついで飽和食塩水 (30 ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物 (赤褐色透明油状物) 25.7 g を得た。このものをジエチルエーテルと混合し、析出した固体をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄 (2 回)、風乾して標記化合物の一方のジアステレオマー (化合物番号 II' - 2 - 1 a) 6.8 g を白色粉末として得た。一方、ろ液を氷冷して析出した固体をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄 (4 回)、風乾して標記化合物のもう一方のジアステレオマー (化合物番号 II' - 2 - 1 b) 3.6 g を白色粉末として得た。

化合物番号 II' - 2 - 1 a : mp 125 ~ 127 °C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.51, 1.54, 1.58 (9H, s), 3.44 (1H, d, J = 9.4 Hz), 3.58 (3H, s), 3.79 (1H, d, J = 9.5 Hz), 5.11, 5.29 (2H, ABq, J = 12.6 Hz), 7.25 ~ 7.48 (10H, m)

IR (nujol) 3408, 1749, 1733, 1676, 1467, 1236, 1145, 1130, 1047, 746, 698

化合物番号 II' - 2 - 1 b : mp 107 ~ 109 °C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.01 (3H, s), 1.56 (6H, s), 3.31, 3.50 (2H, ABq, J = 9.5 Hz), 3.69 (3H, s), 4.98 (1H, s), 5.11 ~ 5.33 (2H, m), 7.11 ~ 7.55 (10H, m)

IR (nujol) 3405, 1747, 1670, 1374, 1304, 1295, 1272, 1207, 1160, 743

実施例 28 2 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシカルボニル - 4 - メチル - 2 - オキソ - 3 - フェニルピロリジン - 1 - イル) - 2 - メチルプロパン酸 (化合物番号 II' - 1 - 1)

実施例 27 で調製した化合物 (II' - 2 - 1 a) 6.8 g 及び (II' - 2 - 1 b) 3.6 g を合した (10.4 g, 0.024 mol)。このもののエタノール 200 ml 中溶液を 10 % パラジウム - カーボン 180 mg と混合し、常圧水素

気流下、室温下で2時間振とうした。反応混合物をろ過して不溶物を除去し、ろ液を減圧下濃縮して白色固体8.7 gを得た。このものを粉碎し、ジエチルエーテル30 mlで洗浄し、ろ取し、ジエチルエーテルで洗浄(1回)、風乾して標記化合物7.6 gを白色粉末として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった(異性体比は $^1\text{H-NMR}$ から61:39)。

mp 184~189°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.45~1.67 (9H, m), 3.43 (1H, d,  $J=9.5\text{ Hz}$ ), 3.70 (3H, s), 3.76 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 7.26~7.56 (5H, m) (以上多い方の異性体); 1.05 (3H, s), 1.45~1.67 (6H, m), 3.32, 3.52 (2H, ABq,  $J=9.6\text{ Hz}$ ), 3.75 (3H, s), 7.26~7.56 (5H, m) (以上少ない方の異性体)

IR (nujol) 3493, 3354, 3500~2500, 1765, 1744, 1720, 1668, 1465, 1247, 1209, 1156, 1019, 946, 740, 702

実施例29 メチル 1-(1-(N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート(化合物番号I-2-23)及びメチル 1-(1-(N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート(化合物番号I-4-17)

実施例28で調製した化合物(II'-1-1) 2.5 g (7.5 mmol)及びピリジン1.3 g (0.016 mol)の1,2-ジクロロエタン25 ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに塩化チオニル1.9 g (0.016 mol)を徐々に加えた。反応混合物を室温下1時間攪拌した。反応混合物を氷冷し、これに3,5-ジクロロアニリン1.6 g (9.9 mmol)の1,2-ジクロロエタン3 ml中溶液を徐々に加えた。反応混合物に更に1,2-ジクロロエタン20 mlを加え、室温下6.5時間攪拌した。反応混合物を氷水80 mlにあげ、有機層

を分離した。水層をクロロホルムで抽出した(20ml×2)。抽出液を先の有機層と合し、1N塩酸(25ml)、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(25ml) 5 ついで飽和食塩水(50ml)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮して粗生成物4.0g(黄褐色樹脂状物)を得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、3:1、v/v)により精製し、白色固体(A)1.7g及び(B)0.40gを得た。(A)をジエチルエーテルで洗浄し、ろ取し、ジエチルエーテルで洗浄(2回)、風乾して標記化合物(化合物番号I-2-23)1.4gを白色粉末として得た。一方、(B)をジエチルエーテルで洗浄し、ろ取し、ジエチルエーテルで洗浄(2回)、風乾して標記化合物(化合物番号I-4-17)0.3gを白色粉末として得た。 10

化合物番号I-2-23: mp 155~156℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67, 1.71 (6H, each s), 1.87 (3H, d, J=1.6Hz), 3.85 (3H, s), 6.65 (1H, q, J=1.7Hz), 7.07 (1H, t, J=1.8Hz), 7.16 15 ~7.31 (2H, m), 7.31~7.45 (3H, m), 7.48 (2H, d, J=1.8Hz), 8.52 (1H, br. s)

IR (nujol) 3366, 1726, 1696, 1655, 1586, 1525, 1453, 1439, 1249, 1236, 1155

化合物番号I-4-17: mp 177~179℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.61, 1.65 (6H, each s), 20 3.80 (3H, s), 4.20~4.46 (2H, m), 5.48 (1H, br. s), 5.61 (1H, br. s), 7.06 (1H, dd, J=1.3, 1.8Hz), 7.30~7.57 (7H, m), 8.66 (1H, br. s)

IR (nujol) 3412, 1745, 1702, 1662, 1582, 1519, 1450, 1412, 1250, 1237 25

実施例30 2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシカルボニル-4-メチル-3-(2-メチルフェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-メチルプロパン酸ベンジル(化合物番号II'-2-4)

(1) メチル N- (1-ベンジルオキシカルボニル-1-メチルエチル) -N- (2-オキソプロピル) -2- (2-メチルフェニル) マロナメート (化合物番号III'-1-1)

参考例8と同様にして調製した化合物 (V'-1-2) 3.3 g (0.016 mol) の1, 2-ジクロロエタン13 ml 中溶液に氷冷下、塩化チオニル1.4 ml (0.018 mol) を加え、外温65℃で1時間ついで還流下2時間加熱攪拌した。冷後、反応液を減圧下濃縮し、2-クロロホルミル-2- (2-メチルフェニル) 酢酸メチルの粗生成物3.6 g を黄色油状物として得た。2-メチル-2- (2-オキソプロピルアミノ) プロパン酸ベンジル4.0 g (0.016 mol) 及びトリエチルアミン2.7 ml (0.019 mol) の乾燥THF 15 ml 中溶液を氷冷下攪拌し、これに上記の粗生成物3.6 g (0.016 mol) を徐々に加えた。反応混合物を室温下一夜攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した (3回)。抽出液を合し、希塩酸、飽和食塩水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液ついで飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、1:1, v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号III'-1-1) 3.3 g を白色結晶として得た。

mp 103~105℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.40 (3H, s), 1.51 (3H, s), 2.03 (3H, s), 2.18 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.87 (1H, d, J=19.8 Hz), 3.99 (1H, d, J=19.8 Hz), 4.60 (1H, s), 5.15 (1H, d, J=12.7 Hz), 5.21 (1H, d, J=12.7 Hz), 6.96~7.40 (9H, m)

IR (nujol) 1732, 1648, 1464, 1456, 1384, 1260, 1212, 1143, 1019, 749, 736, 696

(2) 2- (4-ヒドロキシ-3-メトキシカルボニル-4-メチル-3- (2-メチルフェニル) -2-オキソピロリジン-1-イル) -2-メチルプロパン酸ベンジル (化合物番号II'-2-4)

実施例30の(1)で調製した化合物(III'-1-1) 2.8g (6.4mmol)の乾燥THF 28ml中溶液にDBU 0.6ml (4.0mmol)を加え、室温下30分攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、1:1、v/v)により精製し、標記化合物の一方のジアステレオマー(化合物番号II'-2-4a) 0.5gを白色結晶として、また標記化合物のもう一方のジアステレオマー(化合物番号II'-2-4b) 1.9gを無色透明油状物として得た。

化合物番号II'-2-4a: mp 152~153℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.51 (3H, s), 1.57 (3H, s), 1.61 (3H, s), 2.22 (3H, s), 3.41 (1H, d, J=9.3Hz), 3.55 (3H, s), 3.97 (1H, d, J=9.3Hz), 5.06 (1H, d, J=12.6Hz), 5.27 (1H, d, J=12.6Hz), 7.10~7.38 (9H, m)

IR (nujol) 3393, 1752, 1730, 1676, 1467, 1374, 1237, 1225, 1210, 1142, 1131, 1044, 756, 738, 695

化合物番号II'-2-4b

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 0.94 (3H, s), 1.53 (3H, s), 1.57 (3H, s), 2.25 (3H, s), 3.37 (1H, d, J=9.0Hz), 3.66 (1H, d, J=9.0Hz), 3.68 (3H, s), 5.16 (1H, d, J=12.6Hz), 5.23 (1H, d, J=12.5Hz), 6.94~7.39 (9H, m)

IR (neat) 3500, 1744, 1690, 1456, 1406, 1365, 1248, 1156, 1053, 1004, 977, 749, 699

実施例31 メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート(化合物番号I-2-37)

乾燥窒素気流下、実施例7と同様にして調製した化合物(I-2-48) 0.



16 g (0.34 mmol) のアセトニトリル 15 ml 中溶液にトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I) クロリド 0.33 g (0.35 mmol) を加え、外温 100℃ で 6 時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物を減圧下濃縮し、残渣にエタノール 20 ml を加えた。析出した黄色固体をろ取し、ろ液を減圧下濃縮して樹脂状物 0.4 g を得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、4:1、v/v) により精製し、赤褐色樹脂状物 0.04 g を得た。このものを一夜冷凍庫に放置することにより結晶化させ、ヘキサン-ジエチルエーテル混合液で洗浄し、ろ取し、減圧下乾燥して標記化合物 0.03 g を白色結晶として得た。

mp 72~75℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.69 (3H, s), 1.75 (3H, s), 3.72 (3H, s), 5.88 (1H, d,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 6.96 (1H, d,  $J=5.3\text{ Hz}$ ), 7.00 (1H, dd,  $J=8.6, 2.5\text{ Hz}$ ), 7.21 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.30~7.58 (5H, m), 8.22 (1H, br. s), 8.38 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )

IR (nujol) 3392, 3114, 1747, 1716, 1697, 1608, 1577, 1504, 1452, 1402, 1263, 1253, 1236, 1213, 1147, 1100

実施例 32 3-アセチル-1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-3-フェニル-2-ピロリジノン (化合物番号 II-1-25)

1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-2-プロパノン 1.7 g (6.7 mmol) 及び 2,2,6-トリメチル-5-フェニル-4H-1,3-ジオキシン-4-オン 1.5 g (6.7 mmol) のキシレン 50 ml 中溶液を還流下 2 時間加熱攪拌した。冷後、反応液を減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-クロロホルム、1:3→1:4、v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号 II-1-25) 1.5 g を白色結晶として得た。このものは単一のジアステレオマーとし

て得られた。

mp 153~157℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.03 (3H, s), 1.63 (3H, s),  
1.81 (3H, s), 2.08 (3H, s), 3.35 (1H, d,  $J=9.6$  Hz), 3.61 (1H, d,  $J=9.6$  Hz), 5.09 (1H, s), 7.  
20~7.40 (8H, m)

IR (nujol) 3444, 1684, 1586, 1568, 1456, 1387, 855, 760

- 10 実施例33 2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシカルボニル-4-メチルチオ  
メチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-1-イル)-2-メチルプロパ  
ン酸tert-ブチル (化合物番号II'-3-1)

参考例7で調製した化合物 (IV'-3-3) 1.4 g (5.2 mmol) 及び  
トリエチルアミン0.94 ml (6.7 mmol) の乾燥THF 8 ml 中溶液を  
15 内温-10℃に冷却下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロ  
ホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物1.3 g (5.7 mmol) の乾  
燥THF 4 ml 中溶液を10分で滴下した。反応混合物を同温で30分攪拌した。  
反応混合物に水15 ml 及び酢酸エチル25 ml を加え、有機層を分離した。有  
機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得ら  
20 れた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ヘキサン-酢酸エチル、3:2、  
v/v) により精製し、標記化合物 (化合物番号II'-3-1) 1.9 g を淡黄  
色油状物として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった (異  
性体比は $^1\text{H-NMR}$ から72:28)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.49 (15H, s), 2.11 (3H, s)  
25 ), 2.21 (1H, dd,  $J=13.8, 1.2$  Hz), 2.38 (1H, d,  $J=13.8$  Hz), 3.5~3.7 (2H, m), 3.78 (3H, s), 5.  
07 (1H, s), 7.3~7.5 (5H, m) (以上、多い方の異性体); 1.  
47 (15H, s), 2.07 (3H, s), 2.89 (1H, d,  $J=13.6$  Hz), 3.43 (1H, d,  $J=13.6$  Hz), 3.5~3.7 (2H,

m), 3.73 (3H, s), 5.07 (1H, s), 7.3~7.5 (5H, m) (以上、少ない方の異性体)

IR (neat) 3463, 1737, 1706, 1435, 1368, 1298, 1248, 1148, 912, 848, 732

5

実施例34 メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I-2-56) 及びメチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-メチルチオメチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I-4-32)

(1) 2-(1,3-ジヒドロ-3-メトキシカルボニル-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-1-イル)-2-メチルプロパン酸tert-ブチル (化合物番号I'-3-1) 及び2-(3-メトキシカルボニル-4-メチルチオメチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-1-イル)-2-メチルプロパン酸tert-ブチル (化合物番号I'-4-1)

実施例33で調製した化合物 (II'-3-1) 1.9g (4.4mmol)、トリフェニルホスフィン6.4g (0.024mol) 及び四塩化炭素2.0ml (0.021mol) のアセトニトリル20ml中溶液を外温80℃で2時間加熱攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィにより2回くりかえし精製し (1回目:ヘキサン-酢酸エチル、3:2、v/v; 2回目:ヘキサン-酢酸エチル、2:1、v/v)、標記化合物 (化合物番号I'-3-1) 及び (化合物番号I'-4-1) の混合物1.2gを黄色油状物として得た (<sup>1</sup>H-NMRから混合比は1:2)。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.30 (9H, s), 1.44 (6H, s), 2.37 (3H, s), 3.27 (2H, s), 3.78 (3H, s), 6.78 (1H, br. s), 7.24~7.53 (5H, m) (以上、化合物I'-3-1); 1.20 (9H, s), 1.53 (6H, s), 2.06 (3H, s), 3.77 (3H, s), 4.04~4.25 (2H, m), 6.20 (1H, t,

J = 2.4 Hz), 7.24~7.53 (5H, m) (以上、化合物I'-4-1)

IR (neat) 1738, 1705, 1471, 1447, 1409, 1368, 1298, 1245, 1149, 1024, 850, 752, 698

5

(2) メチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-3-カルボキシレート (化合物番号I'-2-56) 及びメチル 1-(1-(N-(2,5-ジクロロフェニル)カルバモイル)-1-メチルエチル)-4-メチルチオメチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート (化合物番号I'-4-32)

10

実施例34の(1)で調製した化合物(I'-3-1)及び(I'-4-1)の混合物1.2g(2.7mmol)のクロロホルム6ml中溶液にトリフルオロ酢酸6ml(0.078mol)を加え、室温下3時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に水15mlを加えた。このものに10%水酸化ナトリウム水溶液を加えてpHを10とし、ジエチルエーテルで洗浄した。ついで1N塩酸を加えてpHを2とし、酢酸エチルで抽出した(15ml×2)。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮して2-(1,3-ジヒドロ-3-メトキシカルボニル-4-メチルチオメチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール-1-イル)-2-メチルプロパン酸(化合物番号I'-1-1)及び2-(3-メトキシカルボニル-4-メチルチオメチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-1-イル)-2-メチルプロパン酸(化合物番号I'-2-1)の混合物(粗生成物)0.75gを褐色油状物として得た。

15

20

参考例7、実施例33及び実施例34の上記で示される実験をくりかえし行い、化合物(I'-1-1)及び(I'-2-1)の混合物を更に2.4g得た。

25

化合物(I'-1-1)及び(I'-2-1)の混合物3.1g(8.6mmol)、トリフェニルホスフィン3.4g(0.013mol)、四塩化炭素10ml及びジクロロメタン10mlの混合物を還流下1時間加熱攪拌した。冷後、反応混合物を氷冷下攪拌し、これに2,5-ジクロロアニリン1.8g(0.01

1 mol) 及びトリエチルアミン 2.0 ml (0.014 mol) のジクロロメタン 5 ml 中溶液を 15 分で滴下した。反応混合物を室温下一夜攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣を酢酸エチル 30 ml と混合した。このものを水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィにより 2 回くりかえし精製し (1 回目、ヘキサン-酢酸エチル、3 : 2、v/v ; 2 回目、ヘキサン-酢酸エチル-クロロホルム、8 : 1 : 7、v/v)、標記化合物 (化合物番号 I-2-56) 及び (化合物番号 I-4-32) の混合物 0.29 g を黄色樹脂状物として得た (<sup>1</sup>H-NMR から混合比は 1 : 1)。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.70 (3H, s), 1.76 (3H, s), 2.10 (3H, s), 3.20~3.37 (2H, m), 3.74 (3H, s), 6.91 (1H, br. s), 6.93~7.08 (1H, m), 7.15~7.50 (6H, m), 8.25 (1H, br. s), 8.34~8.41 (1H, m) (以上、化合物 I-2-56); 1.61 (3H, s), 1.70 (3H, s), 2.40 (3H, s), 3.74 (3H, s), 4.14~4.38 (2H, m), 6.30 (1H, t, J=2.4 Hz), 6.93~7.08 (1H, m), 7.15~7.50 (6H, m), 8.25 (1H, br. s), 8.34~8.41 (1H, m) (以上、化合物 I-4-32)

IR (CHCl<sub>3</sub>) 3397, 1742, 1717, 1585, 1512, 1409, 1238, 911, 698

実施例 35 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-4-メチル-N,N-ジメチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキサミド (化合物番号 II-1-26)

(1) N,N-ジメチル-2-フェニルマロナミン酸

N,N-ジメチル-2-フェニルマロナミン酸メチル 2.86 g (0.013 mol) の THF 30 ml 中溶液に水酸化カリウム 1.08 g (0.019 mol) の水 5 ml 中溶液を加え、室温下一夜攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、残渣に水 100 ml を加えた。この混合物をジエチルエーテル 50 ml で洗浄後、

塩酸を加えてpHを2とし、クロロホルムで抽出した(30ml×3)。抽出液を合し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣(固体)をジエチルエーテル-ヘキサン混合液で洗浄し、ろ取し、風乾してN, N-ジメチル-2-フェニルマロナミン酸1.72gを白色結晶として得た。

5 mp 122~123.5℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  2.92 (3H, s), 3.06 (3H, s), 3.65 (1H, br. s), 4.65 (1H, s), 7.30~7.41 (5H, m)

(2) 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒ  
10 ドロキシ-4-メチル-N, N-ジメチル-2-オキソ-3-フェニルピロリジ  
ン-3-カルボキサミド(化合物番号II-1-26)

実施例35の(1)で調製したN, N-ジメチル-2-フェニルマロナミン酸  
0.70g (3.4mmol) 及び1, 2-ジクロロエタン20mlの混合物に  
室温下、塩化チオニル0.35ml (4.7mmol)を加え、還流下1.5時  
15 間加熱撹拌した。冷後、反応混合物を減圧下濃縮し、2-クロロホルミル-N,  
N-ジメチル-2-フェニルアセトアミドの粗生成物0.76gを淡黄色油状物  
として得た。

1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチルアミノ)-2-  
プロパノン0.75g (2.9mmol) 及びトリエチルアミン0.52ml  
20 (3.8mmol)の1, 2-ジクロロエタン20ml中溶液を氷冷下撹拌し、  
これに上で調製した2-クロロホルミル-N, N-ジメチル-2-フェニルアセ  
トアミドの粗生成物0.76g (3.4mmol)の1, 2-ジクロロエタン5  
ml中溶液を5分で滴下した(内温5~7℃)。反応混合物を氷冷下1時間つ  
いで室温下一夜撹拌した。反応混合物に水30mlを加え、有機層を分離し、  
25 水層を1, 2-ジクロロエタンで抽出した(20ml×2)。抽出液を先の有機  
層と合し、0.3N塩酸(20ml)、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(20ml)  
1) について飽和食塩水(20ml)で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧  
下濃縮して粗生成物1.50gを得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグ  
ラフィ(ヘキサン-酢酸エチル、3:1、v/v)により精製し、淡黄色固体0.

80 gを得た。このものをジエチルエーテル-ヘキサン混合液で洗浄し、ろ取り、風乾して標記化合物（化合物番号II-1-26）0.67 gを白色結晶として得た。このものは<sup>1</sup>H-NMRから単一のジアステレオマーであった。

mp 174~175. 5°C (dec.)

5     <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 0.93 (3H, s), 1.26 (3H, s), 1.81 (3H, s), 2.50 (3H, s), 3.00 (3H, s), 3.37 (1H, d, J=9.3 Hz), 3.94 (1H, d, J=9.3 Hz), 7.07 (1H, s), 7.21 (3H, s), 7.31 (4H, s)

IR (nujol) 3246, 1696, 1690, 854, 719

10

実施例36   メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-フェニルピペリジン-3-カルボキシレート（化合物番号II-3-3）

15     (1) メチル N-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-N-(3-オキソプロピル)-2-フェニルマロナメート（化合物番号III-1-3）

参考例9で調製した化合物（IV-2-2）1.0 g（3.3 mmol）及びトリエチルアミン0.40 g（4.0 mmol）の1, 2-ジクロロエタン5 ml中溶液を氷冷下攪拌し、これに実施例1と同様にして調製した2-クロロホルミル-2-フェニル酢酸メチルの粗生成物0.70 g（3.3 mmol）の1, 2-ジクロロエタン3 ml中溶液を滴下した。反応混合物を室温下14時間攪拌した。反応混合物に水を加え、有機層を分離した。有機層を水ついで飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（クロロホルム-アセトン、25  
20     : 1、v/v）により精製し、メチル N-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-N-(3, 3-ジメトキシプロピル)-2-フェニルマロナメート（化合物番号III-4-1）1.4 gを淡黄色油状物として得た。

25

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.49 (3H, s), 1.72 (3H, s), 2.0~2.2 (2H, m), 3.43 (6H, s), 3.3~3.8 (2H,

m), 3.68 (3H, s), 4.42 (1H, t,  $J=4.9$  Hz), 4.93 (1H, s), 6.97 (2H, d,  $J=1.8$  Hz), 7.15 (1H, t,  $J=1.8$  Hz), 7.2~7.5 (5H, m)

- 5 化合物(III-4-1) 0.33 g (0.68 mmol) 及びp-トルエン・スルホン酸1水和物33 mg (0.17 mmol) のアセトン3 ml 中溶液を室温下23時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、アセトンを減圧下留去した。残留物に水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(クロロホルム-アセトン、25:1、v/v)により精製し、  
10 標記化合物(化合物番号III-1-3) 0.09 gを淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.52, 1.68 (6H, each s), 2.5~3.0 (2H, m), 3.65 (3H, s), 3.7~4.0 (2H, m), 4.76 (1H, s), 6.9~7.4 (8H, m), 9.75 (1H, s)  
15 s)

(2) メチル 1-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-フェニルピペリジン-3-カルボキシレート(化合物番号II-3-3)

- 20 実施例36の(1)で調製した化合物(III-1-3) 0.09 g (0.21 mmol) 及びトリエチルアミン0.05 g (0.49 mmol) のベンゼン2 ml 中溶液を室温下攪拌し、これに三フッ化ホウ素・ジエチルエーテル錯体1滴を加え、室温下1時間攪拌した。反応混合物に水を加え、有機層を分離した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、不溶の固体をろ取し、風乾して標記化合物(化合物番号II-3-3) 0.05 gを白色結晶として得た。このものは2種類のジアステレオマーの混合物であった(異性体比は $^1\text{H-NMR}$ から2:1)。

mp 168~178°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.69 (6H, s), 1.7~2.2 (2H,



m), 3. 2~3. 4 (1H, m), 3. 65 (3H, s), 3. 7~3. 9 (1H, m), 4. 78 (1H, t, J=4. 2Hz), 7. 0~7. 4 (8H, m) (以上、多い方の異性体); 1. 62, 1. 74 (6H, each s), 1. 7~2. 2 (1H, m), 2. 2~2. 4 (1H, m), 3. 5~3. 7 (2H, m), 3. 75 (3H, s), 4. 62 (1H, t, J=4. 0Hz), 7. 0~7. 4 (8H, m) (以上、少ない方の異性体)

実施例36で示される実験をくりかえし行い、化合物(II-3-3)を更に0. 16g得た。

10 実施例37 メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-2-オキソ-3-フェニルピリジン-3-カルボキシレート(化合物番号I-5-3)

乾燥窒素気流下、実施例36で調製した化合物(II-3-3) 0. 2g (0. 46mmol)、ピリジン0. 11g (1. 4mmol)及び1, 2-ジクロロエタン1. 5mlの混合物を氷冷下撹拌し、これにトリフルオロメタンスルホン酸無水物0. 19g (0. 69mmol)を5分で滴下した。反応混合物を室温下一夜撹拌した後、水及びクロロホルムを加え、有機層を分離した。有機層を水洗し(5ml×2)、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィにより2回くりかえし精製し(1回目: 20 ヘキサン-酢酸エチル、3: 2、v/v; 2回目: クロロホルム-メタノール、200: 1、v/v)、標記化合物0. 05gを白色結晶として得た。

mp 145~148°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1. 44 (3H, s), 1. 56 (3H, s), 3. 66 (3H, s), 4. 0~4. 2 (2H, m), 6. 0~6. 2 (2H, m), 6. 8~7. 3 (8H, m)

IR (nujol) 1750, 1648

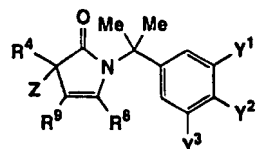
実施例1~37と同様にして製造できる本発明の化合物(I)、(II)及び(I')を以下の表1~表19に実施例1~37で製造される化合物とともに示す。

また実施例 17 の (1) 及び実施例 36 の (1) と同様にして製造できる化合物 (III-b-1) を以下の表 20、21 に実施例 17 の (1) 及び実施例 36 の (1) で製造される化合物とともに示す。

なお表中の mp の欄に記した記号は次のような意味を示す。

- 5      \* 1 : 油状物、樹脂状物またはロウ状固体である化合物。
- \* 2 : 製造後精製せず、次工程の脱離反応に付し、一般式 (I-a-1)、(I-b-1)、  
              (I-c) または (I-d) で示される型の化合物に導いてから構造決定を行った化合物。
- \* 3 : 化合物 (I-3-3) との混合物として得られた (樹脂状物)。
- 10      \* 4 : 化合物 (I-1-10) との混合物として得られた (樹脂状物)。
- \* 5 : 化合物 (I-6-1) との混合物として得られた (実施例 18 参照)。
- \* 6 : 化合物 (I-5-1) との混合物として得られた (実施例 18 参照)。
- \* 7 : 化合物 (I-4-32) との混合物として得られた (実施例 35 参照)。
- \* 8 : 化合物 (I-2-56) との混合物として得られた (実施例 35 参照)。
- 15      # 1 : 2 個以上の不斉中心を有する化合物で 2 個以上のジアステレオマーの混合物として得られた化合物。
- # 2 : 2 個以上の不斉中心を有する化合物で単一のジアステレオマーとして得られた化合物。
- # 3 : 幾何異性が考えられる化合物で 2 個以上の異性体の混合物として得られた
- 20      化合物。
- # 4 : 幾何異性が考えられる化合物で単一の異性体として得られた化合物。

表 1



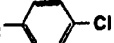


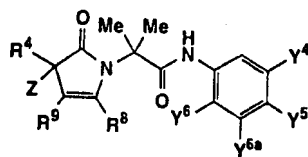
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
I-1-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	132-133
I-1-2	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-3	CO <sub>2</sub> n-Pr	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-4	CO <sub>2</sub> iso-Pr	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-5	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-6	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-7	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - 	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	112-113
I-1-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H		Cl	H	Cl	118-119
I-1-9	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H		Cl	H	Cl	94-95
I-1-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	Et	Me	Cl	H	Cl	*3
I-1-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	Cl	H	Cl	104-106
I-1-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	n-Pr	Cl	H	Cl	132-134
I-1-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	Cl	H	Cl	167-169
I-1-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH=NOH	Cl	H	Cl	85-87 #3
I-1-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH=NOMe	Cl	H	Cl	162-164 #4
I-1-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH=NOAc	Cl	H	Cl	136-138 #4
I-1-17	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CN	Cl	H	Cl	152-153
I-1-18	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH=CH <sub>2</sub>	Cl	H	Cl	88-90
I-1-19	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OH	Cl	H	Cl	152-154
I-1-20	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	H	Cl	94-97
I-1-21	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OAc	Cl	H	Cl	*1
I-1-22	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	Me	Cl	*1
I-1-23	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	MeO	Cl	126-129
I-1-24	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	MeS	Cl	140
I-1-25	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	MeSO	Cl	*1 #1
I-1-26	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	MeSO <sub>2</sub>	Cl	175-176
I-1-27	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	H	133.5-135
I-1-28	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHF <sub>2</sub>	Cl	H	Cl	119-120
I-1-29	CO <sub>2</sub> Me	MeO	H	Me	Cl	H	Cl	134-136
I-1-30	CO <sub>2</sub> Me	iso-PrO	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-31	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	HO	Cl	H	Cl	176-180
I-1-32	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeO	Cl	H	Cl	141-143
I-1-33	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeOCH <sub>2</sub> O	Cl	H	Cl	121-125
I-1-34	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	iso-Pr	Cl	H	Cl	99-102
I-1-35	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> SMe	Cl	H	Cl	154-156
I-1-36	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> SOMe	Cl	H	Cl	156-158 #1
I-1-37	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	Cl	H	Cl	185-187
I-1-38	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	F	163-164
I-1-39	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	Cl	H	Cl	112-113
I-1-40	COMe	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	*1
I-1-41	CONMe <sub>2</sub>	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	157-158.5
I-1-42	CONHtert-Bu	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	141-143

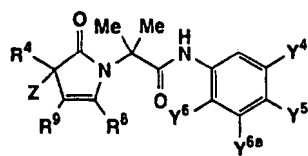
表 2

253



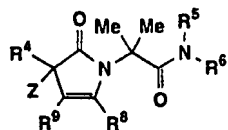
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-2-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	H	163-164
I-2-2	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	H	107-108
I-2-3	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	H	H	H	H	143-145
I-2-4	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	H	H	103-106
I-2-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	H	Me	133-135
I-2-6	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	H	H	H	162-164
I-2-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	H	H	124-126
I-2-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	H	H	125-126
I-2-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Br	H	H	H	148-150
I-2-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	H	H	*1
I-2-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	MeO	H	H	H	88-90
I-2-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CN	H	H	H	153-154
I-2-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	F	H	131-133
I-2-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	Cl	H	119-120
I-2-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	Me	H	124-125
I-2-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	F	H	151-152
I-2-17	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	Me	H	169-171
I-2-18	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	F	H	152-154
I-2-19	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	Cl	H	141-143
I-2-20	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	Me	H	150-153
I-2-21	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	120-122
I-2-22	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	H	F	177-179
I-2-23	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	H	Cl	155-156
I-2-24	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	64-65
I-2-25	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	H	F	H	87-89
I-2-26	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	H	Cl	H	112-114
I-2-27	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	F	H	H	182-183
I-2-28	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	F	Cl	H	159-161
I-2-29	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	142-143
I-2-30	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	Cl	H	H	H	81-82
I-2-31	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	F	H	F	H	83-84
I-2-32	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	Cl	H	Cl	H	122-123
I-2-33	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	Cl	H	F	H	115-116
I-2-34	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	F	H	Cl	H	79-81
I-2-35	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	H	H	136-139
I-2-36	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	F	H	*1
I-2-37	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Cl	H	72-75
I-2-38	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	F	H	*1
I-2-39	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	Cl	H	*1
I-2-40	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	Cl	H	Cl	H	180-181
I-2-41	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	Cl	H	F	H	173-174
I-2-42	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	Cl	H	Cl	H	127-128
I-2-43	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	Cl	H	F	H	164-165
I-2-44	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	F	H	Cl	H	105-107
I-2-45	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	Cl	H	H	H	178-181
I-2-46	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	CF <sub>3</sub>	H	H	H	205-207
I-2-47	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	F	H	F	H	152-154
I-2-48	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	Cl	H	Cl	H	211-213
I-2-49	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	Cl	H	F	H	161-165
I-2-50	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	F	H	Cl	H	199-202

表 3



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-2-51	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	187-188
I-2-52	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CHO	Me	H	H	Me	179-181
I-2-53	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OH	CF <sub>3</sub>	H	H	H	*1
I-2-54	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OH	Cl	H	Cl	H	167-169
I-2-55	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> OAc	Cl	H	Cl	H	116-117
I-2-56	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	CH <sub>2</sub> SMc	Cl	H	Cl	H	*1 *7
I-2-57	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	NHCHO	H	H	H	169-170
I-2-58	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	NHAc	H	H	H	*1
I-2-59	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	NHAc	H	F	H	*1
I-2-60	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OSO <sub>2</sub> Me	H	H	H	61-63
I-2-61	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	SCF <sub>3</sub>	H	H	H	158-160
I-2-62	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	H	*1
I-2-63	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	C≡CH	H	H	H	137-140
I-2-64	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CH=CH <sub>2</sub>	H	Cl	H	165-166
I-2-65	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	C≡CH	H	Cl	H	192-193
I-2-66	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	C≡CH	H	Me	H	195-197
I-2-67	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	C≡CH	H	138-141
I-2-68	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	*1
I-2-69	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	C≡CH	H	H	CF <sub>3</sub>	61-63
I-2-70	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	H	OSO <sub>2</sub> Me	Me	*1

表 4



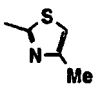
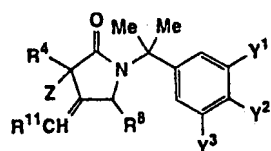
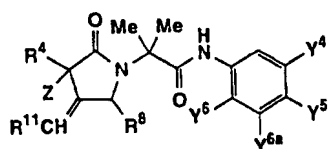
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	mp (°C)
I-2-71	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H		*1

表 5



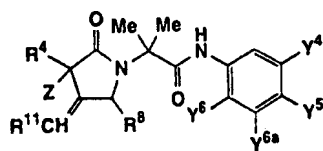
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>11</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
I-3-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Cl	117-119
I-3-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	Me	H	Cl	H	Cl	*1 #2
I-3-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	Et	H	Cl	H	Cl	*4 #2
I-3-4	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	H	Cl	H	Cl	*1
I-3-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	MeSO <sub>2</sub>	Cl	*1
I-3-6	CO <sub>2</sub> Me	iso-PrO	H	H	Cl	H	Cl	*1
I-3-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeS	Cl	H	Cl	107-109#4
I-3-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeSO	Cl	H	Cl	147-150#1#4
I-3-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeSO <sub>2</sub>	Cl	H	Cl	130-132#4
I-3-10	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	H	Cl	H	Cl	146-147
I-3-11	CONMe <sub>2</sub>	Ph	H	H	Cl	H	Cl	*1
I-3-12	CONHtert-Bu	Ph	H	H	Cl	H	Cl	*1

表 6



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>11</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-4-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Cl	H	164-165
I-4-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	H	H	H	160-162
I-4-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	H	H	138-140
I-4-4	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	H	H	126-127
I-4-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Me	H	H	H	*1
I-4-6	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	150-151
I-4-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	MeO	H	H	H	107-108
I-4-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CN	H	H	H	150-151
I-4-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	Cl	H	126-127
I-4-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	Me	H	136-139
I-4-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	F	H	149-150
I-4-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Me	H	172-174
I-4-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Me	H	F	H	148-150
I-4-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Me	H	Me	H	155-157
I-4-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	115-116
I-4-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	F	H	H	F	149-150
I-4-17	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	H	Cl	177-179
I-4-18	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Me	H	H	Me	128-130
I-4-19	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	*1
I-4-20	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	H	F	H	129-131
I-4-21	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	H	Cl	H	91-93
I-4-22	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	Cl	Cl	H	104-105
I-4-23	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	F	H	128-129#4
I-4-24	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	Cl	H	136-138#4
I-4-25	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Cl	H	F	H	123-124#4
I-4-26	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	F	H	Cl	H	108-109#4
I-4-27	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	H	Cl	H	Cl	H	180-181
I-4-28	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	H	Cl	H	F	H	170-171
I-4-29	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	H	Cl	H	Cl	H	78-79
I-4-30	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	H	Cl	H	F	H	143-144
I-4-31	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	H	F	H	Cl	H	60-62
I-4-32	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeS	Cl	H	Cl	H	*1 *8

表 7



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>11</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-4-33	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	OSO <sub>2</sub> Me	H	H	H	65-67
I-4-34	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	SCF <sub>3</sub>	H	H	H	165-167
I-4-35	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	H	*1
I-4-36	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	Cl	H	156-158
I-4-37	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	C≡CH	H	Cl	H	189-190
I-4-38	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	C≡CH	H	Me	H	193-194
I-4-39	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	C≡CH	H	173-175
I-4-40	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	*1
I-4-41	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	C≡CH	H	H	CF <sub>3</sub>	62-64
I-4-42	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Me	H	OSO <sub>2</sub> Me	Me	*1

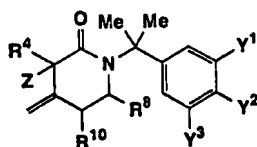


表 8



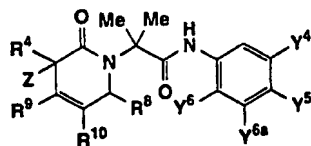
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
I-5-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	131-153 *5
I-5-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	Cl	H	Cl	171-173
I-5-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	Cl	H	Cl	145-148
I-5-4	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	117-120

表 9



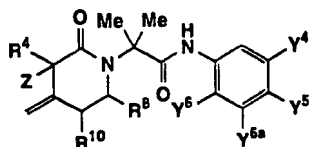
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
I-6-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Cl	131-153 *6

表 10



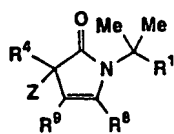
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-7-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	110-111

表 11



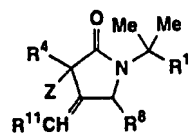
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
I-8-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	Cl	H	Cl	H	183-184

表 1 2



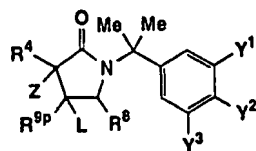
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>1</sup>	mp (°C)
I-9-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-4	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-6	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		138-139.5
I-9-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		146-148
I-9-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		*1
I-9-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me		131-133

表 13



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>1</sup>	mp (°C)
I-10-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		112-114
I-10-4	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-6	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1
I-10-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H		*1

表 14






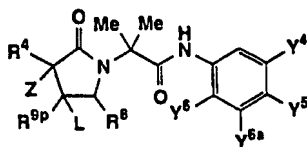
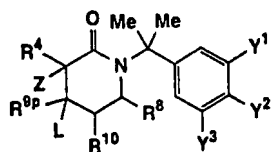
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	L	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
II-1-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	152-158 #1
II-1-2	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	136-141 #1
II-1-3	CO <sub>2</sub> n-Pr	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	*1 #1
II-1-4	CO <sub>2</sub> iso-Pr	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	133-137 #1
II-1-5	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	172-177 #2
II-1-6	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	127-129 #1
II-1-7	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - 	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	145-146 #1
II-1-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H		OH	Cl	H	Cl	207-208(dec.)#2
II-1-9	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H		OH	Cl	H	Cl	196-198 #2
II-1-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	Me	Me	OH	Cl	H	Cl	*1 #1
II-1-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	Et	Me	OH	Cl	H	Cl	*2
II-1-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	OH	Cl	H	Cl	172-175 #2
II-1-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	n-Pr	OH	Cl	H	Cl	152-154 #2
II-1-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	Me	Cl	156-158 #1
II-1-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	MeO	Cl	*2
II-1-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	MeS	Cl	134-136 #1
II-1-17	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	MeSO <sub>2</sub>	Cl	*1 #1
II-1-18	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	H	H	*1 #1
II-1-19	CO <sub>2</sub> Me	MeO	H	Me	OH	Cl	H	Cl	*1 #1
II-1-20	CO <sub>2</sub> Me	iso-PrO	H	Me	OH	Cl	H	Cl	*1 #1
II-1-21	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	iso-Pr	OH	Cl	H	Cl	191-193 #2
II-1-22	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeSCH <sub>2</sub>	OH	Cl	H	Cl	*1 #1
II-1-23	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	F	H	F	161-163 #1
II-1-24	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	200-204(dec.)#1
II-1-25	COMe	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	153-157 #2
II-1-26	CONMe <sub>2</sub>	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	174-175.5(dec.)#2
II-1-27	CONHtert-Bu	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	149-151 #2

表 15



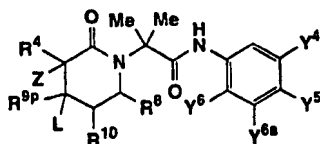
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	L	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
II-2-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	H	106-120 #1
II-2-2	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	OH	Cl	H	Cl	H	148-151 #1
II-2-3	CO <sub>2</sub> Et	Ph	H	Me	OH	H	H	H	H	168-170 #2

表 16



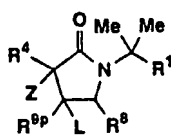
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	R <sup>10</sup>	L	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
II-3-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	OH	Cl	H	Cl	160-162 #2
II-3-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	OH	Cl	H	Cl	*2
II-3-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	OH	Cl	H	Cl	168-178 #1
II-3-4	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	Me	H	OH	Cl	H	Cl	*1 #2

表 17



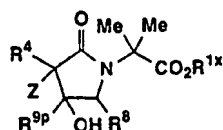
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	R <sup>10</sup>	L	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
II-4-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	OH	Cl	H	Cl	H	*1 #2

表 18



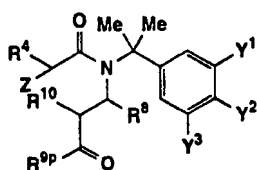
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	L	R <sup>1</sup>	mp (°C)
II-6-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #1
II-6-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #2
II-6-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #1
II-6-4	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-5	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-6	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #1
II-6-7	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		105-108#1
II-6-8	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #2
II-6-9	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-10	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-11	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-12	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #1
II-6-13	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*2
II-6-14	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		*1 #1
II-6-15	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		46-50 #1
II-6-16	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	OH		141-145#1

表 19



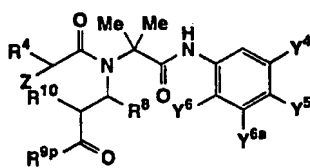
No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	R <sup>1x</sup>	mp (°C)
II'-1-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	184-189 #1
II'-1-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	H	137-140 #2
II'-1-3	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	H	157-160 #1
II'-1-4	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	H	197-200 #1
II'-2-1a	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	125-127 #2
II'-2-1b	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	107-109 #2
II'-2-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Et	CH <sub>2</sub> Ph	109-110 #2
II'-2-3a	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	158-159 #2
II'-2-3b	CO <sub>2</sub> Me	2-F-Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	*1 #2
II'-2-4a	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	152-153 #2
II'-2-4b	CO <sub>2</sub> Me	2-Me-Ph	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	*1 #2
II'-3-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	MeSCH <sub>2</sub>	tert-Bu	*1 #1

表 20



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	mp (°C)
III-1-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	131-132
III-1-2	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	Me	Cl	H	Cl	110-121 #1
III-1-3	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	H	H	Cl	H	Cl	*1
III-1-4	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	*1

表 21



No.	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9p</sup>	R <sup>10</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	Y <sup>6</sup>	Y <sup>6a</sup>	mp (°C)
III-5-1	CO <sub>2</sub> Me	Ph	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	*1



以上の表1～表21に示した化合物のうちmpの欄に\*1を付した化合物は油状物、樹脂状物またはロウ状固体である。これらの化合物の $^1\text{H}$ -NMRスペクトルデータを以下に示す。

5 化合物番号 I-1-2

( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.30 (3H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.73 (6H, s), 1.82 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 4.22~4.40 (2H, m), 6.54 (1H, q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.16~7.37 (8H, m)

10 化合物番号 I-1-3

( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  0.93 (3H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.64~1.79 (2H, m), 1.72, 1.74 (6H, each s), 1.82 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 4.15~4.28 (2H, m), 6.54 (1H, q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.15~7.37 (8H, m)

15

化合物番号 I-1-4

( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.27, 1.29 (6H, each d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 1.58, 1.63 (6H, each s), 1.82 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 5.08~5.18 (1H, m), 6.50 (1H, q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.12~7.36 (8H, m)

20

化合物番号 I-1-5

( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.72, 1.74 (6H, each s), 1.84 (3H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 3.71 (2H, dd,  $J=5.6, 5.8\text{ Hz}$ ), 4.41 (1H, td,  $J=5.6, 12\text{ Hz}$ ), 4.57 (1H, td,  $J=5.8, 12\text{ Hz}$ ), 6.57 (1H, q,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 7.15~7.37 (8H, m)

25

化合物番号 I-1-6

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.70 (9H, s), 5.24 (1H, d, J=12 Hz),  
5.33 (1H, d, J=12 Hz), 6.51 (1H, q, J=1.6 Hz),  
7.14~7.35 (13H, m)

5 化合物番号 I-1-21

实施例15参照

化合物番号 I-1-22

10 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.71 (6H, s), 1.82 (3H, d, J=1.6 Hz),  
2.40 (3H, s), 3.84 (3H, s), 6.55 (1H, q, J=1.6 Hz),  
7.19~7.36 (7H, m)

化合物番号 I-1-25

实施例19参照

15

化合物番号 I-1-30

实施例4参照

化合物番号 I-1-40

20 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.74 (3H, s), 1.79 (3H, d, J=1.6 Hz),  
1.81 (3H, s), 2.20 (3H, s), 6.56 (1H, q, J=1.6 Hz),  
7.00~7.45 (8H, m)

化合物番号 I-2-10

25 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.70, 1.73 (6H, each s), 1.84 (3H, d, J=1.7 Hz),  
2.31 (3H, s), 3.80 (3H, s), 6.65 (1H, q, J=1.7 Hz),  
6.90 (1H, br. d, J=7.2 Hz),  
7.13~7.45 (8H, m), 8.26 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-2-36

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.65 (3H, s), 1.72 (3H, s), 3.73 (3H, s), 5.85 (1H, d, J=5.2Hz), 6.67~6.77 (1H, m), 7.00 (1H, d, J=5.2Hz), 7.00~7.02 (1H, m), 7.32~7.43 (5H, m), 8.05~8.15 (1H, m), 8.19 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-2-38

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67 (3H, s), 1.73 (3H, s), 3.73 (3H, s), 5.86 (1H, d, J=5.0Hz), 6.94 (1H, d, J=5.0Hz), 6.97~7.02 (2H, m), 7.33~7.43 (5H, m), 8.20 (1H, br. s), 8.20~8.34 (1H, m)

## 化合物番号 I-2-39

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.66 (3H, s), 1.73 (3H, s), 3.70 (3H, s), 5.87 (1H, d, J=5.0Hz), 6.66~6.76 (1H, m), 6.96 (1H, d, J=5.2Hz), 7.17~7.48 (6H, m), 8.15 (1H, dd, J=10.8, 3.0Hz), 8.20 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-2-53

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.71 (3H, s), 1.76 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.35 (2H, br. s), 6.99 (1H, br. s), 7.25~7.50 (7H, m), 7.72~7.80 (2H, m), 8.45 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-2-58

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67 (3H, s), 1.72 (3H, s), 1.86 (3H, d, J=1.6Hz), 2.13 (3H, s), 3.82 (3H, s), 6.

6.3~6.69 (1H, m), 7.15~7.40 (9H, m), 7.66 (1H, br. s), 8.26 (1H, br. s)

化合物番号 I-2-59

5 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.64 (3H, s), 1.72 (3H, s), 1.84 (3H, d, J=1.7 Hz), 2.12 (3H, s), 3.78 (3H, s), 6.64 (1H, q, J=1.7 Hz), 6.96~7.06 (1H, m), 7.21~8.02 (8H, m), 8.12 (1H, br. s)

10 化合物番号 I-2-62

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.70, 1.73 (6H, each s), 1.85 (3H, d, J=1.6 Hz), 3.80 (3H, s), 5.23 (1H, d, J=11 Hz), 5.73 (1H, d, J=18 Hz), 6.59~6.73 (2H, m), 7.11~7.39 (8H, m), 7.55~7.61 (1H, m), 8.36 (1H, br. s)

化合物番号 I-2-68

20 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.70, 1.74 (6H, each s), 1.88 (3H, d, J=1.6 Hz), 3.83 (3H, s), 4.35 (1H, d, J=11 Hz), 5.81 (1H, d, J=17 Hz), 6.61~6.75 (2H, m), 7.23~7.42 (6H, m), 7.68 (1H, br. s), 7.83 (1H, br. s), 8.59 (1H, br. s)

化合物番号 I-2-70

25 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.67 (3H, s), 1.75 (3H, s), 1.82 (3H, d, J=1.6 Hz), 2.28 (6H, s), 3.21 (3H, s), 3.73 (3H, s), 6.63 (1H, d, J=1.6 Hz), 6.80 (1H, s), 7.22~7.35 (5H, m), 7.80 (1H, s), 8.41 (1H, s)

## 化合物番号 I-2-71

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.66 (3H, s), 1.70 (3H, s), 1.85 (3H, d, J=1.5 Hz), 2.32 (3H, s), 3.98 (3H, s), 6.52 (1H, s), 6.61~6.68 (1H, m), 7.24~7.40 (5H, m), 9.20~9.50 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-3-2 (単一のジアステレオマー)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.43 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.62 (3H, s), 1.72 (3H, s), 3.77 (3H, s), 4.73 (1H, q, J=6.4 Hz), 5.35 (1H, s), 5.53 (1H, s), 7.10~7.65 (8H, m)

## 化合物番号 I-3-4

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.56 (3H, s), 1.62 (3H, s), 4.19~4.32 (2H, m), 5.14 (1H, d, J=12.4 Hz), 5.22 (1H, br. s), 5.39 (1H, d, J=12.4 Hz), 5.44 (1H, br. s), 7.10~7.47 (13H, m)

## 20 化合物番号 I-3-5

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.62 (3H, s), 1.66 (3H, s), 3.31 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.32~4.49 (2H, m), 5.43 (1H, br. s), 5.59 (1H, br. s), 7.33~7.41 (7H, m)

25

## 化合物番号 I-3-6

実施例4参照

## 化合物番号 I-3-11

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.66, 1.67 (6H, each s), 2.65 (3H, br. s), 2.70 (3H, br. s), 4.12 (1H, dt, J=12.5, 1.6 Hz), 4.48 (1H, dt, J=12.5, 2.0 Hz), 4.86 (1H, t, J=1.8 Hz), 5.34 (1H, d, J=1.6 Hz),  
5 7.09 (2H, d, J=1.8 Hz), 7.19~7.40 (6H, m)

化合物番号 I-3-12

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.29 (9H, s), 1.70 (3H, s), 1.77 (3H, s), 4.04 (1H, s), 4.15 (1H, d, J=11.8 Hz),  
10 4.28 (1H, d, J=10.4 Hz), 5.45 (1H, d, J=1.6 Hz), 7.13~7.47 (8H, m), 8.11 (1H, br. s)

化合物番号 I-4-5

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.65, 1.67 (6H, each s), 2.31 (3H, s), 3.76 (3H, s), 4.25~4.40 (2H, m), 5.42 (1H, br. s), 5.57 (1H, br. s), 6.89 (1H, br. d, J=7.2 Hz), 7.12~7.51 (8H, m), 8.43 (1H, br. s)  
15 )

20 化合物番号 I-4-19

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.64, 1.68 (6H, each s), 3.81 (3H, s), 4.28~4.48 (2H, m), 5.51 (1H, br. s), 5.64 (1H, br. s), 7.35~7.49 (5H, m), 7.56 (1H, br. s), 8.11 (2H, br. s), 9.05 (1H, br. s)

25

化合物番号 I-4-35

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.66, 1.68 (6H, each s), 3.76 (3H, s), 4.31~4.36 (2H, m), 5.23 (1H, d, J=12 Hz), 5.40~5.47 (1H, m), 5.54~5.61 (1H, m), 5.74

(1H, dd,  $J=0.9, 1.8\text{Hz}$ ), 6.66 (1H, dd,  $J=11, 1.8\text{Hz}$ ), 7.09~7.56 (9H, m), 8.53 (1H, br. s)

化合物番号 I-4-40

5 (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.65, 1.68 (6H, each s), 3.78 (3H, s), 4.33~4.37 (2H, m), 5.34 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 5.40~5.50 (1H, m), 5.60~5.64 (1H, m), 5.81 (1H, d,  $J=17\text{Hz}$ ), 6.68 (1H, dd,  $J=11, 17\text{Hz}$ ), 7.31~7.50 (6H, m), 7.66 (1H, br. s), 7.85 (1  
10 H, br. s), 8.76 (1H, br. s)

化合物番号 I-4-42

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.56 (3H, s), 1.65 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.71 (3H, s), 4.21~4.42 (2H, m), 5.37 (1H, s), 5.54 (1H, s), 6.74 (1H, s), 7.26~7.51 (5H, m), 8.00 (1H, s), 8.54 (1H, s)

化合物番号 I-9-1

20 (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.70 (6H, s), 1.85 (3H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 6.66 (1H, q,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 7.15 (2H, s), 7.25~7.34 (5H, m)

化合物番号 I-9-2

25 (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.73 (6H, s), 1.85 (3H, d,  $J=1.6\text{Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 6.62 (1H, q,  $J=1.6\text{Hz}$ ), 7.11 (1H, dd,  $J=1.8, 5.3\text{Hz}$ ), 7.18~7.51 (6H, m), 8.30 (1H, d,  $J=5.3\text{Hz}$ )

## 化合物番号 I-9-3

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.75 (3H, s), 1.81 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.82 (3H, s), 3.80 (3H, s), 6.66 (1H, q, J=1.6 Hz), 7.13 (1H, dd, J=0.8, 7.8 Hz), 7.18~  
5 7.41 (6H, m), 7.54 (1H, t, J=7.8 Hz)

## 化合物番号 I-9-4

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.81 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.89, 1.92 (6H, each s), 3.81 (3H, s), 6.57 (1H, q, J=1.6 Hz), 7.19~7.56 (7H, m), 7.66 (1H, ddd, J=8.4, 6.8, 1.6 Hz), 7.76 (1H, dd, J=7.9, 1.3 Hz), 7.93~8.17 (2H, m)

## 化合物番号 I-9-5

15 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.82 (3H, d, J=1.7 Hz), 1.91, 1.92 (6H, each s), 3.82 (3H, s), 6.57 (1H, q, J=1.7 Hz), 7.17~7.28 (2H, m), 7.28~7.44 (3H, m), 7.46~7.61 (1H, m), 7.61~7.82 (2H, m), 8.03 (1H, d, J=2.5 Hz), 8.08 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.  
20 89 (1H, d, J=2.5 Hz)

## 化合物番号 I-9-6

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.82 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.89 (3H, s), 1.95 (3H, s), 3.79 (3H, s), 6.69 (1H, q, J=1.6 Hz), 7.14~7.42 (5H, m), 7.42~7.73 (4H, m), 7.88 (1H, d, J=8.0 Hz), 9.17 (1H, s)

## 化合物番号 I-9-7

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.82 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.85, 1.86



(6H, each s), 3.80 (3H, s), 6.58 (1H, q,  $J=1.6$  Hz), 7.13~7.56 (8H, m), 7.97 (1H, br. s)

化合物番号 I-9-8

5 (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.82 (3H, s), 1.84 (3H, d,  $J=1.6$  Hz), 2.01 (3H, s), 2.80 (3H, s), 3.79 (3H, s), 6.74 (1H, q,  $J=1.6$  Hz), 7.18~7.40 (5H, m), 7.41~7.57 (1H, m), 7.69~8.03 (3H, m)

10 化合物番号 I-9-9

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.62, 1.63 (6H, each s), 1.77 (3H, d,  $J=1.7$  Hz), 3.76 (3H, s), 6.03 (1H, s), 6.52~6.72 (3H, m), 6.73~6.90 (2H, m), 7.15~7.45 (5H, m)

15

化合物番号 I-9-11

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.69, 1.73 (6H, each s), 1.77 (3H, d,  $J=1.6$  Hz), 3.80 (3H, s), 5.84 (2H, s), 6.39 (1H, d,  $J=1.6$  Hz), 6.54 (1H, d,  $J=8.4$  Hz), 6.59 (1H, d,  $J=2.3$  Hz), 6.75 (1H, dd,  $J=8.4, 2.3$  Hz), 7.21~7.41 (5H, m)

20

化合物番号 I-9-13

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.74 (3H, s), 1.75 (3H, d,  $J=1.6$  Hz), 1.77 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.25 (4H, s), 6.32 (1H, d,  $J=1.6$  Hz), 6.78~6.86 (3H, m), 7.23~7.39 (5H, m)

25

化合物番号 I-9-14

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.71, 1.74 (6H, each s), 1.79 (3H, d, J=1.6 Hz), 3.84 (3H, s), 4.25~4.27 (2H, m), 4.32~4.34 (2H, m), 6.46 (1H, d, J=1.6 Hz), 6.77 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.88 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.22~7.37 (5H, m)

化合物番号 I-9-15

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.75 (3H, d, J=1.4 Hz), 1.85, 1.87 (6H, each s), 3.81 (3H, s), 6.33 (1H, q, J=1.4 Hz), 6.72 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.24~7.46 (7H, m), 7.55 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.61 (1H, d, J=2.2 Hz)

化合物番号 I-10-1

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.60, 1.63 (6H, each s), 3.81 (3H, s), 4.29~4.46 (2H, m), 5.47~5.51 (1H, m), 5.54~5.58 (1H, m), 7.11 (2H, s), 7.31~7.45 (5H, m)

化合物番号 I-10-2

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.64, 1.67 (6H, each s), 3.80 (3H, s), 4.22~4.36 (1H, m), 4.36~4.47 (1H, m), 5.31~5.44 (1H, m), 5.50~5.60 (1H, m), 7.06 (1H, dd, J=1.7, 5.3 Hz), 7.19 (1H, dd, J=0.5, 1.7 Hz), 7.29~7.52 (5H, m), 8.26 (1H, dd, J=0.5, 5.3 Hz)

化合物番号 I-10-4

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.80 (3H, s), 1.89 (3H, s), 3.75 (3

H, s), 4.30~4.50 (2H, m), 5.34 (1H, br. s), 5.50 (1H, br. s), 7.27~7.53 (7H, m), 7.62 (1H, dd,  $J=8.5, 6.9$  Hz), 7.74 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.86 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 8.02 (1H, d,  $J=8.6$  Hz)

5

化合物番号 I-10-5

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.83, 1.86 (6H, each s), 3.78 (3H, s), 4.31 (1H, dt,  $J=13.6, 2.3$  Hz), 4.38 (1H, dt,  $J=13.6, 2.0$  Hz), 5.28~5.42 (1H, m), 5.46~5.56 (1H, m), 7.28~7.39 (3H, m), 7.39~7.57 (3H, m), 7.57~7.73 (2H, m), 7.93 (1H, d,  $J=2.3$  Hz), 8.07 (1H, dd,  $J=8.9, 0.9$  Hz), 8.88 (1H, d,  $J=2.3$  Hz)

10

15 化合物番号 I-10-6

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.83 (3H, s), 1.93 (3H, s), 3.76 (3H, s), 4.28~4.57 (2H, m), 5.27~5.39 (1H, m), 5.42~5.55 (1H, m), 7.20~7.41 (3H, m), 7.41~7.69 (6H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.0$  Hz), 9.11 (1H, s)

20

化合物番号 I-10-7

(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.59 (6H, s), 3.71 (3H, s), 4.24 (1H, dt,  $J=13.5, 2.2$  Hz), 4.32 (1H, dt,  $J=13.5, 2.0$  Hz), 5.21~5.32 (1H, m), 5.37~5.48 (1H, m), 5.99 (1H, s), 6.41~6.57 (1H, m), 6.57~6.69 (1H, m), 6.69~6.88 (2H, m), 7.18~7.40 (3H, m), 7.40~7.59 (2H, m)

25

## 化合物番号 I-10-8

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.81, 1.85 (6H, each s), 3.77 (3H, s), 4.24 (1H, dt, J=13.7, 2.3 Hz), 4.32 (1H, dt, J=13.7, 2.0 Hz), 5.28~5.39 (1H, m), 5.43~5.56 (1H, m), 7.17~7.41 (4H, m), 7.41~7.54 (2H, m), 7.54~7.68 (2H, m), 7.87~8.12 (2H, m), 8.84 (1H, br. s)

## 化合物番号 I-10-9

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.62, 1.63 (6H, each s), 3.80 (3H, s), 4.21~4.26 (2H, m), 5.34 (1H, t, J=2.1 Hz), 5.49 (1H, br. s), 5.85 (1H, d, J=3.6 Hz), 5.95 (1H, d, J=3.6 Hz), 6.48 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.78 (1H, d, J=2.3 Hz)

15

化合物番号 II-1-3 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比 70 : 30)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 0.86 (3H, t, J=7.4 Hz), 1.53 (3H, s), 1.56~1.67 (2H, m), 1.69, 1.72 (6H, each s), 3.56 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.91 (1H, dd, J=2.0, 9.6 Hz), 4.07~4.18 (2H, m), 7.21~7.44 (8H, m) (以上多い方の異性体); 0.72 (3H, t, J=7.4 Hz), 1.05 (3H, s), 1.56~1.67 (5H, m), 1.83 (3H, s), 3.34 (1H, d, J=9.6 Hz), 3.64 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.07~4.18 (2H, m), 5.13 (1H, s), 7.21~7.44 (8H, m) (以上少ない方の異性体)

25

化合物番号 II-1-10 (4個のジアステレオマーの混合物、異性体比 A : B : C : D = 57 : 27 : 8 : 8)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.10 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.34~1.97 (9H, m), 3.59~4.07 (4H, m), 7.15~7.59 (8H, m) (以上異性体A); 1.00 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.34~1.97 (9H, m), 3.59~4.07 (4H, m), 7.15~7.59 (8H, m) (以上異性体B); 0.93 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.34~1.97 (9H, m), 3.59~4.07 (4H, m), 7.15~7.59 (8H, m) (以上異性体C); 0.78 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.34~1.97 (9H, m), 3.59~4.07 (4H, m), 7.15~7.59 (8H, m) (以上異性体D)

10

化合物番号II-1-17 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比6:4)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 0.88 (1H, br. s), 1.26 (3H, s), 1.68 (3H, s), 1.70 (3H, s), 3.33 (3H, s), 3.61 (1H, d, J=9.7 Hz), 3.77 (3H, s), 3.96 (1H, d, J=9.6 Hz), 7.26~7.52 (7H, m) (以上多い方の異性体); 1.12 (3H, s), 1.60 (3H, s), 1.87 (3H, s), 3.32 (3H, s), 3.39 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.67 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.78 (3H, s), 7.26~7.52 (7H, m) (以上少ない方の異性体)

20

化合物番号II-1-18 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比6:4)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 0.88 (1H, br. s), 1.58 (3H, br. s), 1.74 (3H, s), 1.76 (3H, s), 3.49~3.68 (1H, m), 3.74 (3H, s), 3.85 (1H, d, J=9.7 Hz), 7.20~7.43 (9H, m) (以上多い方の異性体); 1.04 (3H, s), 1.70 (3H, s), 1.86 (3H, s), 3.26 (1H, d, J=11 Hz), 3.49~3.68 (1H, m), 3.75 (3H, s), 5.03 (1H, s), 7.20~7.43 (9H, m) (以上少ない方の異性体)

25

化合物番号II-1-19 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比3:2)  
(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.42 (3H, s), 1.58~1.76 (6H, m), 3.  
35~3.92 (8H, m), 7.18~7.30 (3H, m) (以上多い方の  
異性体); 1.26 (3H, s), 1.58~1.76 (6H, m), 3.35  
5 ~3.92 (8H, m), 7.18~7.30 (3H, m) (以上少ない方の異  
性体)

化合物番号II-1-20 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比2:1)  
実施例3参照

10

化合物番号II-1-22 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比2:1)  
実施例22参照

化合物番号II-3-4 (単一のジアステレオマー)

15 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.29 (3H, s), 1.65 (3H, s), 1.82 (3  
H, s), 1.70~2.00 (2H, m), 3.40~3.60 (1H, m),  
3.70~3.90 (1H, m), 4.98 (1H, d, J=12.4Hz),  
5.41 (1H, br. s), 5.44 (1H, d, J=12.4Hz), 7.  
12~7.31 (13H, m)

20

化合物番号II-4-1 (単一のジアステレオマー)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.40 (3H, s), 1.68 (3H, s), 1.71 (3  
H, s), 1.70~1.95 (2H, m), 3.35~3.55 (1H, m),  
3.65~3.80 (1H, m), 3.73 (3H, s), 5.42 (1H, b  
25 r. s), 6.97 (1H, dd, J=2.5, 8.6Hz), 7.25 (1H,  
d, J=8.6Hz), 7.20~7.40 (5H, m), 8.08 (1H, b  
r. s), 8.44 (1H, d, J=2.5Hz)

化合物番号II-6-1 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比1:1)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.10 (3H, s), 1.57 (3H, s), 1.70 (3H, s), 3.49 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.60 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.76 (3H, s), 7.26~7.39 (2H, m) (以上一方の異性体); 1.55 (3H, s), 1.66 (3H, s), 1.85 (3H, s), 3.67 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.77 (3H, s), 3.94 (1H, d, J=9.8 Hz), 7.26~7.39 (2H, m) (以上もう一方の異性体)

化合物番号II-6-2 (単一のジアステレオマー)

10 (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.10 (3H, s), 1.62 (3H, s), 1.87 (3H, s), 3.39 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.66 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.76 (3H, s), 5.02 (1H, br. s), 7.20~7.46 (7H, m), 8.33 (1H, d, J=5.3 Hz)

15 化合物番号II-6-3 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比4:3)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.12 (3H, s), 1.77 (6H, s), 3.49 (1H, d, J=9.9 Hz), 3.64 (1H, d, J=9.9 Hz), 3.75 (3H, s), 5.09 (1H, br. s), 7.09~7.45 (7H, m), 7.53~7.71 (1H, m) (以上多い方の異性体); 1.54 (3H, s), 1.68 (3H, s), 1.87 (3H, s), 3.64 (1H, d, J=9.9 Hz), 3.72 (3H, s), 4.02 (1H, d, J=9.9 Hz), 7.09~7.45 (7H, m), 7.53~7.71 (1H, m) (以上少ない方の異性体)

25 化合物番号II-6-6 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比3:2)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.55 (3H, s), 1.73 (3H, s), 2.05 (3H, s), 3.59~3.83 (4H, m), 4.05 (1H, d, J=10.0 Hz), 7.23~7.48 (5H, m), 7.48~7.73 (2H, m), 7.73~7.87 (2H, m), 7.87~8.01 (1H, m), 9.10

(1H, s) (以上多い方の異性体); 1. 13 (3H, s), 1. 87 (3H, s), 1. 98 (3H, s), 3. 49 (1H, d, J=9. 9Hz), 3. 59~3. 83 (4H, m), 7. 23~7. 48 (5H, m), 7. 48~7. 73 (2H, m), 7. 73~7. 87 (2H, m), 7. 87~8. 01 (1H, m), 9. 19 (1H, s) (以上少ない方の異性体)

化合物番号II-6-8 (単一のジアステレオマー)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1. 21 (3H, s), 1. 85 (3H, s), 1. 93 (3H, s), 2. 93 (3H, s), 3. 56 (1H, d, J=9. 9Hz), 3. 71 (3H, s), 3. 74 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 19~7. 43 (3H, m), 7. 48~7. 67 (3H, m), 7. 81 (1H, ddd, J=1. 4, 6. 9, 8. 3Hz), 7. 90~8. 11 (2H, m)

化合物番号II-6-12 (2個のジアステレオマーの混合物)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1. 04 (3H, s), 1. 51 (3H, s), 1. 56 (3H, s), 1. 18 (1H, br. s), 3. 49 (1H, d, J=10. 1Hz), 3. 75 (3H, s), 3. 84 (1H, dd, J=9. 8, 2. 1Hz), 5. 86 (1H, d, J=3. 6Hz), 5. 95 (1H, d, J=3. 6Hz), 6. 58 (1H, d, J=2. 3Hz), 6. 91 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 31~7. 47 (5H, m) (以上多い方の異性体); 1. 65 (3H, s), 1. 68 (3H, s), 1. 78 (3H, s), 3. 28 (1H, d, J=9. 9Hz), 3. 54 (1H, d, J=10. 5Hz), 3. 76 (3H, s), 5. 02 (1H, s), 5. 86 (1H, d, J=3. 6Hz), 5. 95 (1H, d, J=3. 6Hz), 6. 58 (1H, d, J=2. 3Hz), 6. 90 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 31~7. 47 (5H, m) (以上少ない方の異性体)

化合物番号II-6-14 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比3:2)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1. 51 (3H, s), 1. 70 (3H, s), 1. 73 (3



H, s), 3.48 (1H, d, J=9.8 Hz), 3.76 (3H, s), 3.83 (1H, d, J=9.8 Hz), 4.24~4.28 (2H, m), 4.32~4.35 (2H, m), 6.85 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.97 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.31~7.49 (5H, m) (以上多い方の異性体); 1.03 (3H, s), 1.66 (3H, s), 1.82 (3H, s), 3.26 (1H, d, J=9.9 Hz), 3.54 (1H, d, J=9.9 Hz), 3.76 (3H, s), 4.24~4.28 (2H, m), 4.32~4.35 (2H, m), 6.85 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.94 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.31~7.49 (5H, m) (以上少ない方の異性体)

化合物番号II'-2-3b (単一のジアステレオマー)

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.0~1.1 (3H, m), 1.5~1.6 (6H, m), 3.28 (1H, d, J=9.5 Hz), 3.54 (1H, d, J=9.5 Hz), 3.72 (3H, s), 5.21 (2H, s), 5.50 (1H, s), 6.8~7.1 (2H, m), 7.2~7.6 (7H, m)

化合物番号II'-2-4b (単一のジアステレオマー)

実施例30参照

20

化合物番号II'-3-1 (2個のジアステレオマーの混合物、異性体比72:28)

実施例33参照

25 化合物番号III-1-3

実施例36参照

化合物番号III-1-4

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.51 (3H, s), 1.66 (3H, s), 2.07 (3

H, s), 2.3~2.9 (2H, m), 3.6~3.9 (2H, m), 4.82 (1H, br. s), 5.12 (2H, s), 6.99 (2H, d, J=1.9 Hz), 7.16 (1H, t, J=1.9 Hz), 7.23~7.36 (10 H, m)

5

化合物番号III-5-1

(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.52 (3H, s), 1.59 (3H, s), 2.10 (3 H, s), 2.38~2.56 (1H, m), 2.70~2.90 (1H, m), 3.65 (3H, s), 3.55~3.80 (2H, m), 4.89 (1H, s  
10 ), 7.00 (1H, dd, J=4.3, 1.0 Hz), 7.26 (1H, d, J=4.3 Hz), 7.33 (5H, s), 7.90 (1H, s), 8.50 (1H, d, J=1.0 Hz)

またmpの欄に\*3を付した化合物(I-1-10)及び\*4を付した化合物  
15 (I-3-3)は分離困難な混合物として得られた(異性体比(I-1-10):(I-3-3)=3:2)。これらの化合物の<sup>1</sup>H-NMRスペクトルデータを以下に示す。

(CDCl<sub>3</sub>) δ 0.92 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.71 (3H, s), 1.81 (3H, s), 1.88 (3H, s), 1.95~2.17 (2H,  
20 m), 3.88 (3H, s), 7.15~7.70 (8H, m) (以上化合物(I-1-10)); 0.96 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.05~1.28 (2H, m), 1.61 (3H, s), 1.77 (3H, s), 3.75 (3H, s), 4.30~4.40 (1H, m), 5.37 (1H, s), 5.46 (1H, s), 7.15~7.70 (8H, m) (以上化合物(I-3-3)、  
25 単一のジアステレオマー)

製剤例1

乳剤

化合物I-1-5

20重量%

キシレン	5.7 重量%
ジメチルホルムアミド	1.8 重量%
ポリエチレングリコールエーテル（ノニポール 85™）	5 重量%

を混合して乳剤を得る。（水に適宜希釈して使用）

5

#### 製剤例 2

##### 水和剤

	化合物 I - 3 - 2	5.0 重量%
	リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%
10	ポリエチレングリコールエーテル（ノニポール 85™）	5 重量%
	クレイ	3.5 重量%
	ホワイトカーボン	5 重量%

を混合粉碎して水和剤を得る。（水に適宜希釈して使用）

#### 15 製剤例 3

##### 粒剤

	化合物 I - 1 - 1	1.5 重量%
	リグニンスルホン酸ナトリウム	2 重量%
	ベントナイト	56.5 重量%
20	タルク	4.0 重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

#### 製剤例 4

##### 粒剤

25	化合物 I - 2 - 1	1.5 重量%
	リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%
	ベントナイト	93.5 重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

## 製剤例 5

## 粒剤

	化合物 I - 3 - 1	3 重量%
	リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%
5	ベントナイト	3 0 重量%
	クレイ	6 2 重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

## 製剤例 6

## 10 乳剤

	化合物 I - 3 - 1 0	2 0 重量%
	キシレン	5 7 重量%
	ジメチルホルムアミド	1 8 重量%
	エマルミン 1 1 0	5 重量%

15 を混合して乳剤を得る。(水に適宜希釈して使用)

## 製剤例 7

## 水和剤

	化合物 I - 3 - 1	5 0 重量%
20	リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%
	エマルミン 1 1 0	5 重量%
	クレイ	3 5 重量%
	ホワイトカーボン	5 重量%

を混合粉碎して水和剤を得る。(水に適宜希釈して使用)

25

## 製剤例 8

## 粒剤

	化合物 I - 1 - 3 9	3 重量%
	リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%

ベントナイト	30重量%
クレイ	62重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

#### 5 製剤例 9

##### 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物 I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
10	ニューポール PE-68	10.0重量%
	セロゲン 7A	5.0重量%
	トキサノン GR-50L	10.0重量%
	ネオコール YS-K	3.0重量%
	パーライト	48.91重量%

15 を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。

#### 製剤例 10

##### 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
20	化合物 I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポール PE-68	10.0重量%
	セロゲン 7A	5.0重量%
	トキサノン GR-50L	10.0重量%
25	ネオコール YS-K	5.0重量%
	パーライト	46.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。

#### 製剤例 11

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
5	ニューポールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
	オルフィンE1010	3.0重量%
	パーライト	48.91重量%
10	を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。	

## 製剤例12

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
15	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
20	オルフィンE1010	5.0重量%
	パーライト	46.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。

## 製剤例13

## 25 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-64	10.0重量%

	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
	ネオコールYS-K	5.0重量%
	パーライト	46.91重量%
5	を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。	

## 製剤例14

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
10	化合物I-1-1	2.1重量%
	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
	ネオコールYS-K	5.0重量%
	パーライト	76.91重量%
15	を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。	

## 製剤例15

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
20	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューボールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	10.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
25	オルフィンE1010	3.0重量%
	パーライト	43.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。

## 製剤例16

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
5	ニューポールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	10.0重量%
	トキサノンGR-50L	5.0重量%
	オルフィンE1010	3.0重量%
	パーライト	48.91重量%
10	を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。	

## 製剤例17

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
15	化合物I-1-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	5.0重量%
20	オルフィンE1010	3.0重量%
	パーライト	53.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得た。

## 製剤例18

## 25 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物I-1-39	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-68	10.0重量%



セロゲン7A	5.0重量%
トキサノンGR-50L	10.0重量%
ネオコールYS-K	5.0重量%
パーライト	46.91重量%

5 を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

#### 製剤例19

##### 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
10	化合物I-3-1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-68	10.0重量%
	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
15	オルフィンE1010	3.0重量%
	パーライト	48.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

#### 製剤例20

##### 20 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物I-3-10	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポールPE-68	10.0重量%
25	セロゲン7A	5.0重量%
	トキサノンGR-50L	10.0重量%
	オルフィンE1010	5.0重量%
	パーライト	46.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

## 製剤例 2 1

## 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
5	化合物 I - 2 - 1	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポール P E - 6 4	10.0重量%
	セロゲン 7 A	5.0重量%
	トキサノン G R - 5 0 L	10.0重量%
10	ネオコール Y S - K	5.0重量%
	パーライト	46.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

## 製剤例 2 2

## 15 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物 I - 2 - 1 4	2.1重量%
	セロゲン 7 A	5.0重量%
	トキサノン G R - 5 0 L	10.0重量%
20	ネオコール Y S - K	5.0重量%
	パーライト	76.91重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

## 製剤例 2 3

## 25 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99重量%
	化合物 I - 2 - 1 6	2.1重量%
	カワカゾール	20.0重量%
	ニューポール P E - 6 8	10.0重量%

セロゲン 7 A	10.0 重量%
トキサノン GR-50 L	10.0 重量%
オルフィン E1010	3.0 重量%
パーライト	43.91 重量%

5 を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

#### 製剤例 24

##### 水面浮遊性粒剤

	イマゾスルフロン	0.99 重量%
10	化合物 I-4-17	2.1 重量%
	カワカゾール	20.0 重量%
	ニューポール PE-68	10.0 重量%
	セロゲン 7 A	10.0 重量%
	トキサノン GR-50 L	5.0 重量%
15	オルフィン E1010	3.0 重量%
	パーライト	48.91 重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して水面浮遊性粒剤を得る。

#### 製剤例 25～40

20 水溶性フィルムで包装した水面浮遊性粒剤

製剤例 9～24 の水面浮遊性粒剤（それぞれ 25～50 g）を、それぞれポリビニルアルコールのフィルムで包装して得る。

#### 製剤例 41

25 水性懸濁剤

イマゾスルフロン	1.98 重量%
化合物 I-1-1	4.2 重量%
アグリゾール FL-2017	1.0 重量%
ネオコール YS-K	1.0 重量%

	クニピアF	1. 5重量%
	セロゲン6A	0. 5重量%
	エチレングリコール	15. 0重量%
	アンチフォームE-20	0. 2重量%
5	ソルビン酸	0. 05重量%
	ソルビン酸カリウム	0. 15重量%
	水	74. 42重量%

の混合物を攪拌し湿式粉碎して水性懸濁剤を得た。

#### 10 試験例1 水田出芽後処理試験

150cm<sup>2</sup>の角型プラスチック製ポットに水田土壌をつめ、入水、代かき後、タイヌビエ、タマガヤツリ、イヌホタルイ及びキカシグサの種子をまき、湛水2cmで所定の期間栽培した。単子葉雑草が1葉期まで、キカシグサが2葉期まで生育したとき、湛水を3cmとし、化合物(I)を含む薬剤希釈液を所定の薬量

15 (g/a)となるようにポットの水面に滴下処理した。なお薬剤希釈液は化合物(I)3.0mgをトゥイーン(Tween)20を2%含むアセトン1mlに溶解し、純水で全量を10mlとした後、これを更に純水で希釈して所定濃度に調製した。薬剤処理後の植物は温室内で栽培し、処理3週間後に各雑草に対する除草効果を表22に示した基準によって評価した。結果は表23～24に示した。

20

表22

#### 除草効果

指数	効果	抑制率(殺草率)(%)
0	無	0
1	小	0. 1～50. 0
2	中	50. 1～75. 0
3	大	75. 1～87. 5
4	極大	87. 6～99. 9
5	極大(完全枯死)	100

#### 薬害

指数	薬害	被害率(%)
----	----	--------

0	無	0
1	微	0. 1 ~ 1 2. 5
2	小	1 2. 6 ~ 2 5. 0
3	中	2 5. 1 ~ 5 0. 0
4	大	5 0. 1 ~ 9 9. 9
5	極大 (完全枯死)	1 0 0

表 23

化合物番号	g/a	タイヌピエ	タマガヤツリ	イヌホタルイ	キカシグサ
I-1-1	10	5	5	4	5
I-1-5	10	5	5	4	5
I-1-19	10	5	4	4	5
I-1-20	10	5	4	4	4
I-1-21	10	5	5	4	5
I-1-27	10	5	4	4	4
I-1-38	10	5	4	4	4
I-1-39	10	5	4	4	4
I-1-40	10	5	5	4	5
I-2-1	10	5	4	4	5
I-2-4	10	5	5	5	5
I-2-5	10	5	5	4	5
I-2-7	10	5	5	4	5
I-2-8	10	5	5	4	5
I-2-12	10	5	5	4	4
I-2-13	10	5	5	4	5
I-2-14	10	5	5	4	4
I-2-15	10	5	4	4	4
I-2-16	10	5	4	4	4
I-2-17	10	5	5	4	4
I-2-18	10	5	4	4	4
I-2-19	10	5	5	4	4
I-2-21	10	5	5	4	4
I-2-22	10	5	4	4	4
I-2-23	10	5	4	4	4
I-2-38	10	5	4	4	4
I-2-61	10	5	5	4	4
I-2-62	10	5	5	4	4
I-2-63	10	5	5	4	5

表 24

化合物番号	g/a	タイヌピエ	タマガヤツリ	イヌホタルイ	キカシグサ
I-2-65	10	5	5	4	4
I-2-71	10	5	4	4	4
I-3-1	10	5	5	4	5
I-3-10	10	5	4	4	4
I-4-1	10	5	5	4	5
I-4-3	10	5	5	4	5
I-4-4	10	5	4	4	4
I-4-6	10	5	5	4	5
I-4-8	10	5	5	4	5
I-4-9	10	5	5	4	5
I-4-11	10	5	5	4	5
I-4-12	10	5	5	4	4
I-4-13	10	5	4	4	4
I-4-15	10	5	5	4	4
I-4-16	10	5	4	4	4
I-4-17	10	5	5	4	4
I-4-18	10	5	5	4	5
I-4-20	10	5	4	4	4
I-4-21	10	5	4	4	4
I-4-26	10	5	4	4	4
I-4-27	10	5	4	4	5
I-4-34	10	5	5	4	5
I-4-35	10	5	5	4	4
I-4-36	10	5	5	4	4
I-4-37	10	5	5	4	4
I-4-41	10	5	5	4	5
I-9-1	10	5	5	4	4
I-9-16	10	5	5	4	4
I-10-1	10	5	5	4	5

表 2 3 ～ 2 4 より本発明の化合物は優れた除草活性を有することがわかる。

#### 試験例 2 水田出芽前処理試験

5      1 5 0 c m<sup>2</sup>の角型プラスチック製ポットに水田土壌をつめ、入水、代かき後、  
タイヌビエ及びイヌホタルイの種子をまいた。湛水を 3 c mとし、化合物 (I)  
を含む薬剤希釈液を所定の薬量 (g / a) となるようにポットの水面に滴下処理  
した。なお薬剤希釈液は試験例 1 と同様の方法により調製した。薬剤処理後の植  
物は温室内で栽培し、処理 3 週間後に各雑草に対する除草効果を表 2 2 に示した  
基準によって評価した。結果は表 2 5 ～ 2 7 に示した。



表 25

化合物番号	g/a	タイヌビエ	イヌホタルイ	化合物番号	g/a	タイヌビエ	イヌホタルイ
I-1-1	10	5	5	I-2-12	10	5	5
I-1-2	10	5	5	I-2-13	10	5	5
I-1-4	10	5	5	I-2-14	10	5	5
I-1-13	10	5	5	I-2-15	10	5	5
I-1-16	10	5	5	I-2-16	10	5	5
I-1-19	10	5	5	I-2-17	10	5	5
I-1-20	10	5	5	I-2-18	10	5	5
I-1-21	10	5	5	I-2-19	10	5	5
I-1-23	10	5	5	I-2-20	10	5	5
I-1-25	10	5	5	I-2-21	10	5	5
I-1-26	10	5	5	I-2-22	10	5	5
I-1-27	10	5	5	I-2-23	10	5	5
I-1-32	10	5	5	I-2-25	10	5	5
I-1-38	10	5	5	I-2-26	10	5	5
I-1-39	10	5	5	I-2-31	10	5	5
I-1-40	10	5	5	I-2-32	10	5	5
I-2-1	10	5	5	I-2-33	10	5	5
I-2-2	10	5	5	I-2-34	10	5	5
I-2-3	10	5	5	I-2-35	10	5	5
I-2-4	10	5	5	I-2-36	10	5	5
I-2-5	10	5	5	I-2-37	10	5	5
I-2-6	10	5	5	I-2-38	10	5	5
I-2-7	10	5	5	I-2-39	10	5	5
I-2-8	10	5	5	I-2-41	10	5	5
I-2-9	10	5	5	I-2-54	10	5	5
I-2-10	10	5	5	I-2-55	10	5	5
I-2-11	10	5	5	I-2-57	10	5	5

表 26

化合物番号	g/a	タイムピエ	イヌホタルイ	化合物番号	g/a	タイムピエ	イヌホタルイ
I-2-60	10	5	5	I-4-12	10	5	5
I-2-61	10	5	5	I-4-13	10	5	5
I-2-62	10	5	5	I-4-14	10	5	5
I-2-63	10	5	5	I-4-15	10	5	5
I-2-64	10	5	5	I-4-16	10	5	5
I-2-65	10	5	5	I-4-17	10	5	5
I-2-67	10	5	5	I-4-18	10	5	5
I-2-69	10	5	5	I-4-19	10	5	5
I-2-71	10	5	5	I-4-20	10	5	5
I-3-1	10	5	5	I-4-21	10	5	5
I-3-2	10	5	5	I-4-22	10	5	5
I-3-5	10	5	5	I-4-23	10	5	5
I-3-8	10	5	5	I-4-24	10	5	5
I-3-9	10	5	5	I-4-25	10	5	5
I-3-10	10	5	5	I-4-26	10	5	5
I-3-12	10	5	5	I-4-27	10	5	5
I-4-1	10	5	5	I-4-28	10	5	5
I-4-2	10	5	5	I-4-29	10	5	5
I-4-3	10	5	5	I-4-30	10	5	5
I-4-4	10	5	5	I-4-31	10	5	5
I-4-5	10	5	5	I-4-33	10	5	5
I-4-6	10	5	5	I-4-34	10	5	5
I-4-7	10	5	5	I-4-35	10	5	5
I-4-8	10	5	5	I-4-36	10	5	5
I-4-9	10	5	5	I-4-37	10	5	5
I-4-10	10	5	5	I-4-38	10	5	5
I-4-11	10	5	5	I-4-39	10	5	5

表 27

化合物番号	g/a	タイヌピエ	イヌホタルイ
I-4-40	10	5	5
I-4-41	10	5	5
I-5-3	10	5	5
I-9-1	10	5	5
I-9-2	10	5	5
I-9-3	10	5	5
I-9-4	10	5	5
I-9-5	10	5	5
I-9-7	10	5	5
I-9-8	10	5	5
I-9-9	10	5	5

化合物番号	g/a	タイヌピエ	イヌホタルイ
I-9-10	10	5	5
I-9-13	10	5	5
I-9-14	10	5	5
I-10-1	10	5	5
I-10-2	10	5	5
I-10-3	10	5	5
I-10-4	10	5	5
I-10-5	10	5	5
I-10-6	10	5	5
I-10-7	10	5	5
I-10-9	10	5	5

表 2 5 ～ 2 7 より本発明の化合物は優れた除草活性を有することがわかる。

### 試験例 3 水田出芽後処理試験

1 / 1 0 0 0 0 a のプラスチック製ポットに水田土壌をつめ、入水、代かき後、  
5 タイヌビエの種子をまき、湛水 4 c m で所定の期間栽培した。タイヌビエが 1 .  
5 葉期または 2 . 5 葉期まで生育した時、化合物 ( I ) を含む薬剤希釈液を所定  
の薬量 ( g / a ) となるようにポットの水面に滴下処理した。また 1 / 1 0 0 0  
0 a のプラスチック製ポットに水田土壌をつめ、入水、代かき後、イネ稚苗 1 株  
を 2 c m の深さに移植し、湛水を 4 c m として化合物 ( I ) を含む薬剤希釈液を  
10 所定の薬量 ( g / a ) となるようにポットの水面に滴下処理した。なお薬剤希釈  
液は試験例 1 と同様の方法により調製した。薬剤処理後の植物は温室内で栽培し、  
処理 3 週間後にタイヌビエに対する除草効果及び移植イネに対する薬害を表 2 2  
に示した基準によって評価した。結果は表 2 8 ～ 2 9 に示した。

表 28

化合物番号	g/a	タイヌピエ(1.5葉期)	タイヌピエ(2.5葉期)	イネ葉害
I-1-1	2.5 5	4 5	4 4	0 0
I-1-27	2.5 5	5 5	4 4	0 0
I-1-38	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-1-39	2.5 5	5 5	4 4	0 0
I-1-40	2.5 5	5 5	4 5	0 0
I-2-1	2.5 5	4 5	4 4	0 0
I-2-2	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-2-14	2.5 5	4 5	4 4	0 0
I-2-16	2.5 5	5 5	4 5	0 0
I-2-17	2.5 5	4 5	4 4	0 0
I-2-18	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-2-23	2.5 5	4 5	4 5	0 0
I-2-40	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-2-63	2.5 5	5 5	4 4	0 0
I-2-71	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-3-1	2.5 5	5 5	4 5	0 0
I-3-9	2.5 5	5 5	4 4	0 0
I-3-10	2.5 5	5 5	4 4	0 0

表 29

化合物番号	g/a	タイヌビエ(1.5葉期)	タイヌビエ(2.5葉期)	イネ葉害
I-3-12	2.5 5	4 5	4 4	0 0
I-4-13	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-4-15	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-4-17	2.5 5	5 5	4 5	0 0
I-4-27	2.5 5	5 5	4 5	0 0
I-4-37	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-9-1	2.5 5	4 4	4 4	0 0
I-10-1	2.5 5	4 4	4 4	0 0

表 28～29より本発明の化合物はイネに薬害がなく、タイヌビエに対して優れた除草活性を有することがわかる。

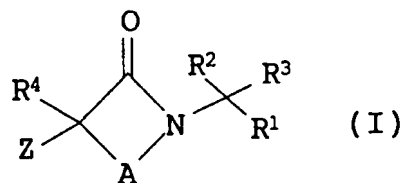
#### 産業上の利用可能性

- 5      本発明の化合物（I）またはその塩は低薬量で広範囲の雑草、例えば水田雑草、畑地雑草等に対して優れた殺草作用を有する。しかも栽培植物、例えばイネ、コムギ、オオムギ、ダイズ、トウモロコシ、ワタ等に対して薬害が少なく、優れた選択的除草効果を示す。また選択的除草効果は長期間持続する。哺乳動物や魚貝類に対して低毒性で、環境を汚染することもなく、水田、畑、果樹園あるいは非農耕地用等の除草剤としてきわめて安全に使用することができる。
- 10

また、本発明の化合物（I）またはその塩を含有する水面浮遊性粒剤および水性懸濁剤は、短時間で水中に有効成分を行き渡らせることができるので、水田の広範囲の雑草防除が可能となり、薬害の心配もない。

## 請求の範囲

## 1. 一般式



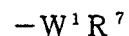
[式中、 $R^1$ は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $R^5$ 及び $R^6$ はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。)で表される基を示し、

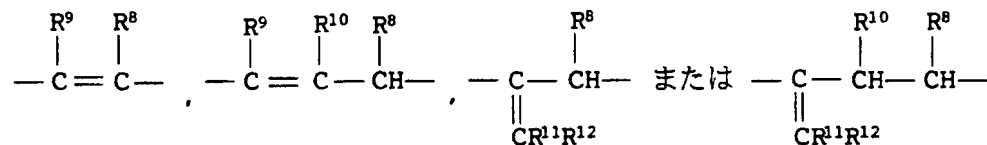
$R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示すか、または $R^2$ 及び $R^3$ は隣接する炭素原子と一緒に置換されていてもよい3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、

$R^4$ は置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $W^1$ は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $R^7$ は置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。)で表される基を示し、

$-A-$ は式



(式中、 $R^8$ は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、 $R^9$ は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基または式

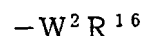




(式中、 $R^{15}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す。) で表される基を示し、

$R^{10}$ は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、

$R^{11}$ は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または式



(式中、 $W^2$ は酸素原子または酸化されていてもよい硫黄原子を、 $R^{16}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示す。) で表される基を示し、

$R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子または置換されていてもよい炭化水素基を示し、ここで、 $R^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $R^9$ または $=C(R^{11})R^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。) で表される基を示し、

Zはハロゲン原子、シアノ基、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよいアシル基または式



(式中、 $R^{5a}$ 及び $R^{6a}$ はそれぞれ水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示す。) で表される基を示す。]で表される化合物またはその塩。

2.  $R^1$ は[1] $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラールキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基(該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、

- (1) ヒドロキシ基、
- (2) アミノ基、
- (3) シアノ基、
- (4) スルファモイル基、
- (5) スルファモイルオキシ基、

(6)メルカプト基、

(7)ニトロ基、

(8)ハロゲン原子、

- 5 (9)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1  
15 ～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、  
20 ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基  
25 からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されて

いてもよい) から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、

- (10)ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基, 5～6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基 (該アシル基がアルキルカルボニル基, アルケニルカルボニル基, アルキニルカルボニル基, アルコキシカルボニル基, アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ, シアノ, スルファモイル, メルカプト, カルボキシ,  $C_{1-6}$ アルキルチオ基, ハロゲン原子,  $C_{1-6}$ アルコキシ基, ニトロ基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基, アミノ, モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基,  $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

- 該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5～6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル基,  $C_{2-6}$ アルケニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル基, ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基, ホルミル基,  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基,  $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基,  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基,  $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基,  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基,  $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基, C

$_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)

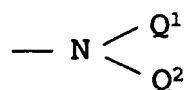
- (11) 式-T-Q<sup>0</sup> [式中、Q<sup>0</sup>は(a)それぞれハロゲンで1～5個置換されていてもよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換

されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基、または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカル

- ボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、  
 5  $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてよい。)を、TはO、  
 -S(O)<sub>k</sub>- (kは0、1または2を示す)またはS-Sを示す]で表される  
 10 基、

(12)式



- [式中、 $Q^1$ は(a)水素原子、(b)それぞれハロゲンで1~5個置換されていて  
 もよい(i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケ  
 15 ニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル  
 基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基または(c)  
 ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル  
 基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、  
 20  $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニ  
 ル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボ  
 ニル基、5~6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5~6  
 25 員複素環アセチル基から選ばれるアシル基(該アシル基がアルキルカルボニル  
 基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニ  
 ル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の  
 場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-}$

<sub>6</sub>アルキルチオ基, ハロゲン原子, C<sub>1-6</sub>アルコキシ基, ニトロ基, C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基, アミノ, モノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基, C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1~3個置換されていてもよく、

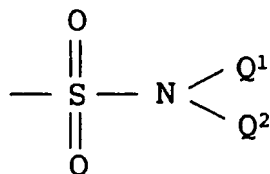
- 5      該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5~6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル基, ハロゲン
- 10      で1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基, ホルミル基, C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基, C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシカルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシカルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル
- 15      オキシカルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシカルボニル基, ニトロ基, アミノ基, ヒドロキシ基, シアノ基, スルファモイル基, メルカプト基, ハロゲン原子およびC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよい。)を、Q<sup>2</sup>は(a)それぞれハロゲンで1~5個置換されていても
- 20      よい(i) C<sub>1-6</sub>アルキル基, (ii) C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基, (iii) C<sub>2-6</sub>アルケニル基, (iv) C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基, (v) C<sub>2-6</sub>アルキニル基, (vi) C<sub>6-14</sub>アリール基, (vii) C<sub>7-19</sub>アラルキル基, (viii) C<sub>8-20</sub>アリールアルケニル基および(ix) C<sub>8-20</sub>アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基または(b)ホルミル基, C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基, C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシカルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシカルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシカルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボニル
- 25

基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、5  
ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換  
10 されている）もよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1  
15 ～3個置換されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル  
20 オキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換され  
25 ている）もよい。）を、または $Q^1$ および $Q^2$ は隣接する窒素原子とともに3ないし7員環を形成してもよい。）で表される基、

(13)式





〔式中の記号は前記と同意義を示す〕で表される基、

- (14) (a) (i)  $\text{C}_{1-6}$ アルキル基, (ii)  $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基, (iii)  $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基, (iv)  $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基, (v)  $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基, (vi)  $\text{C}_{6-14}$ アリール基, (vii)  $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基, (viii)  $\text{C}_{8-20}$ アリールアルケニル基および (ix)  $\text{C}_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基, (b) ハロゲンで1～3個置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $\text{C}_{6-14}$ アリールオキシ基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ  $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルチオ基お

よび $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換  
されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオ  
キシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子  
および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘ  
テロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベン  
ゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および  
硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原  
子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$   
アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリー  
ルカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ  
カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアル  
キルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$   
アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～  
6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセ  
チル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケ  
ニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アル  
ケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒド  
ロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチ  
オ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカル  
ボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ  
イミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されて  
いてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロ  
アルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカル  
ボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮  
合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1  
～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$   
アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲン

- で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ
- 5 ルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されて
- 10 いてもよい。)で1ないし2個置換されていてもよいカルバモイル基、
- (15) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b) ハ
- 15 ロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されてい
- てもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、
- 20  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ
- 25 ルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル

基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロ

アルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラ  
5 ルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。) で1ないし2個置換されていてもよいカルバモイルオキシ基、  
15 (16) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハロ  
20 ゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、  
25  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$

- 9 アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル
- 5 スルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチ
- 10
- 15
- 20
- 25

オ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されているとしてもよく、

- 5      該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されているとしてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_2$
- 10    $_{-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されているとしてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル
- 15   オキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されているとしてもよい。)で1ないし2個置換されているとしてもよいウレイド基、
- 20   (17) (a) (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、(ii)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(iii)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(iv)  $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、(v)  $C_{2-6}$ アルキニル基、(vi)  $C_{6-14}$ アリール基、(vii)  $C_{7-19}$ アラルキル基、(viii)  $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および(ix)  $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基、(b)ハロ
- 25   ゲンで1～3個置換されているとしてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されているとしてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、

- $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基または(c)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5~



- 6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換されている）もよく、
- 10 該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されている）もよい。）で1ないし2個置換されている）もよいチオカルバモイル基、
- 25 (18)カルボキシル基、
- (19)式 $-O-SO_2-Q^2$ 〔式中、 $Q^2$ は前記と同意義を示す〕で表される基、
- (20)スルホ基、
- (21)式 $=N-OR^{14}$ 〔式中、 $R^{14}$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基またはハロゲ

ンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を示す]で表される基および

(22)  $C_{3-6}$ シクロアルキル基からなる群(以下、置換基群(A))から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。

- 5      上記炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、
- 10

- [2]ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原
- 15
- 20
- 25

子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルス  
 ルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチ  
 オ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリール  
 チオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、また  
 5 は隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒  
 素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたは  
 ジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3  
 ～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキ  
 シド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化  
 10 されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環  
 との縮合環基または

[3]式



（式中、 $R^5$ 及び $R^6$ はそれぞれ(1)水素原子、(2) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シク  
 15 ロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
 ニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル  
 基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基  
 がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記  
 置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化  
 20 水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、  
 アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記  
 置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい  
 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロ  
 アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキ  
 25 ル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換  
 基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）または(3)ハロゲン  
 で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、  
 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$   
 アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい

- $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基を示す。）で表される基を示し、

$R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、

アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群 (A) から選ばれる 1~4 個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群 (A) から選ばれる置換基、ハロゲンで 1~5 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub> アルケニル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニル基、C<sub>6-14</sub> アリール基および C<sub>7-19</sub> アラルキル基から選ばれる置換基で 1~5 個置換されていてもよく、隣接する 2 つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。) を示すか、または R<sup>2</sup> 及び R<sup>3</sup> は隣接する炭素原子と一緒にあって、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub> アルケニル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニル基、C<sub>6-14</sub> アリール基、C<sub>7-19</sub> アラルキル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルコキシ基、C<sub>2-6</sub> アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub> アルキニルオキシ基、C<sub>6-14</sub> アリールオキシ基、C<sub>7-19</sub> アラルキルオキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub> アルキル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルケニル-カルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニル-カルボニル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルキル-カルボニル基、C<sub>6-14</sub> アリール-カルボニル基、C<sub>1-6</sub> アルコキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルケニルオキシ-カルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニルオキシ-カルボニル基、C<sub>3-6</sub> シクロアルキルオキシ-カルボニル基、C<sub>6-14</sub> アリールオキシ-カルボニル基、C<sub>7-19</sub> アラルキル-カルボニル基、C<sub>7-19</sub> アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub> アルケニルスルフィニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニルスルフィニル基、C<sub>6-14</sub> アリールスルフィニル基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub> アルケニルスルホニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニルスルホニル基、C<sub>6-14</sub> アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ C<sub>1-6</sub> アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、C<sub>1-6</sub> アルキル-カルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで 1~3 個置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキルチオ基、C<sub>2-6</sub> アルケニルチオ基、C<sub>2-6</sub> アルキニ

ルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい、3ないし8員の環状炭化水素基を形成してもよく、

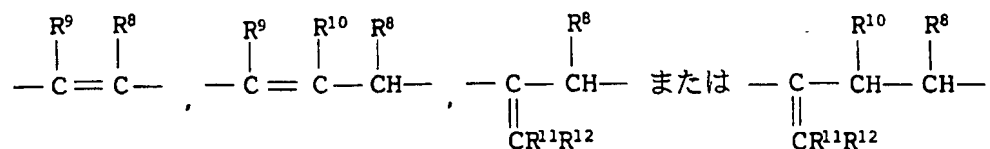
- 5  $R^4$ は(1) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラ  
ルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基か  
ら選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキ  
10 ニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置  
換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケ  
ニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアル  
キニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロ  
ゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル  
基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$   
15  $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換さ  
れていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形  
成してもよい。）、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキ  
ル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル  
基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲン  
20 で1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ  
基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキル  
オキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルカル  
ボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルカルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルカルボ  
ニル基、 $C_{6-14}$ アリールカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{2-6}$   
25  $C_{2-6}$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシカルボニル基、  
 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシカルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシカルボニ  
ル基、 $C_{7-19}$ アラルキルカルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシカルボニ  
ル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、  
 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ ア

- リールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、
- 5 ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成
- 10 してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3
- 15 ～8員複素環との縮合環基または(3)式
- $$-W^1R^7$$

- （式中、 $W^1$ は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫黄原子を、 $R^7$ は(1) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換
- 20 基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオ
- 25

キシ基を形成してもよい。) または(2)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基を示す。)で表される基を示し、  
-A-は式





- (式中、 $\text{R}^8$ は水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基、 $\text{C}_{8-20}$ アリールアルケニル基および $\text{C}_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群
- 5 (A) から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記
- 10 置換基群 (A) から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基および $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)を示し、
- 15  $\text{R}^9$ は(1)水素原子、(2)シアノ基、(3) $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基、 $\text{C}_{7-19}$ アラルキル基、 $\text{C}_{8-20}$ アリールアルケニル基および $\text{C}_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群 (A) から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化
- 20 水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群 (A) から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、 $\text{C}_{6-14}$ アリール基および $\text{C}_{7-19}$
- 25 アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する

- 2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、(4)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子(オキシド化されていてもよい)、酸素原子および硫黄原子(モノまたはジオキシド化されていてもよい)から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基、(5)ホルミル基、

C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基, C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシ-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基, 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基および5~6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基(該アシル基がアルキルカルボニル基, アルケニルカルボニル基, アルキニルカルボニル基, アルコキシカルボニル基, アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合, ヒドロキシ, シアノ, スルファモイル, メルカプト, カルボキシ, C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基, ハロゲン原子, C<sub>1-6</sub>アルコキシ基, ニトロ基, C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基, アミノ, モノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基, C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1~3個置換されていてもよく,

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基, アリールカルボニル基, シクロアルキルオキシカルボニル基, アリールオキシカルボニル基, アラルキルカルボニル基, アラルキルオキシカルボニル基, 5~6員複素環カルボニル基, 縮合複素環カルボニル基または5~6員複素環アセチル基の場合, ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル基, ハロゲンで1~3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基, ホルミル基, C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニル-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニル-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキル-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリール-カルボニル基, C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ-カルボニル基, C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ-カルボニル基, C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシ-カルボニル基, C<sub>6-14</sub>アリールオキシ-カルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキル-カルボニル基, C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシ-カルボニル基, ニトロ基, アミノ基, ヒドロキシ基, シアノ基, スルファモイル基, メルカプト基, ハロゲン原子およびC<sub>1-6</sub>アルキ

ルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。)、または(6)式



- (式中、 $R^{15}$ は(i)水素原子、(ii) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基(該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群(A)から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A)から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、または(iii)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置

- 換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1
- 5 個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1～3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環基または該3～8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3～8員複素環との縮合環基を示す。）で表される基を示し、
- 10  $R^{10}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはア
- 20 リールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）を示し、
- 25  $R^{11}$ は(1)水素原子、(2)ハロゲン原子、(3) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアル

- キル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群
- 5 (A) から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群(A) から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。)、(4)ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、
- 15  $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1～3
- 20 個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$
- 25

- アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲン  
で1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ  
基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれ  
る1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一  
緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されてい  
てもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよ  
い）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~  
8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、  
酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ば  
れるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基、または(5)式  
-W<sup>2</sup>R<sup>16</sup>  
(式中、W<sup>2</sup>は酸素原子またはモノもしくはジオキシド化されていてもよい硫  
黄原子を、R<sup>16</sup>は(i)水素原子、(ii) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル  
基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$   
アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および  
 $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアル  
キル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換  
基群（A）から選ばれる1~4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水  
素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、  
アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上  
記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1~5個置換されていても  
よい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$   
シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$   
アラルキル基から選ばれる置換基で1~5個置換されていてもよく、隣接する  
2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）、  
(iii)ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シク  
ロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、ハロゲンで1~3個置換  
されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アル

- キニルオキシ基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルフィニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルスルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、 $C_{6-14}$ アリールスルホニル基、ニトロ基、アミノ基、モノもしくはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$ アルキニルチオ基および $C_{6-14}$ アリールチオ基からなる群から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよく、または隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環基または該3~8員複素環基とベンゼン環もしくは窒素原子（オキシド化されていてもよい）、酸素原子および硫黄原子（モノまたはジオキシド化されていてもよい）から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む3~8員複素環との縮合環基、または(iv)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル



基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、  
 5 アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、アミノ、モノ又はジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3個置換  
 10 されている）もよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロアルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置換  
 15 されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されている）もよい。 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$   
 20 アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキルオキシ-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリールオキシ-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキル-カルボニル基、 $C_{7-19}$ アラルキルオキシ-カルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子および $C_{1-6}$ アルキルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されている）もよい。）を示す。）で表される基を示し、

$R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_8$

$-_{20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）を示し、  
 ここで、 $R^8$ が結合する炭素原子はアミドの窒素原子と結合し、 $R^9$ または $=CR^{11}R^{12}$ が結合する炭素原子はZが結合する炭素原子と結合する。）で表される基を示し、

Zは(1)ハロゲン原子、(2)シアノ基、(3) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基がアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の場合、該炭化水素基は、上記置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）  
 (4)ホルミル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルケニル-カルボニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル-カルボニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル-カルボニル基、 $C_{6-14}$ アリール-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、 $C_{2-}$

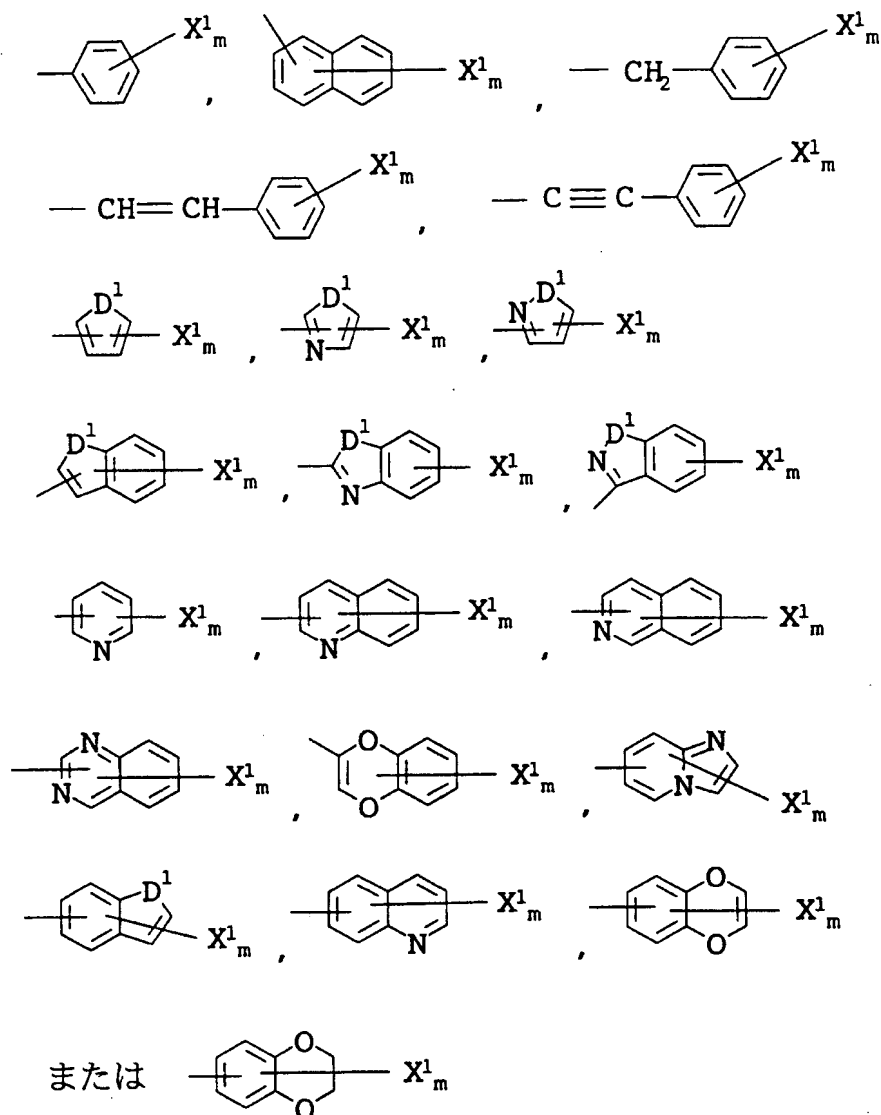
<sub>6</sub>アルケニルオキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシカルボニル基、  
 C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボ  
 ニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルオキシカル  
 ボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素環カルボニル基および5～  
 5 6員複素環アセチル基から選ばれるアシル基（該アシル基がアルキルカルボニ  
 ル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アルコキシカルボ  
 ニル基、アルケニルオキシカルボニル基またはアルキニルオキシカルボニル基  
 の場合、ヒドロキシ、シアノ、スルファモイル、メルカプト、カルボキシ、C  
 1-6アルキルチオ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ニトロ基、C<sub>1-6</sub>ア  
 10 ルコキシカルボニル基、アミノ、モノ又はジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>  
<sub>6</sub>アルコキシイミノ基およびヒドロキシイミノ基から選ばれる置換基で1～3  
 個置換されていてもよく、

該アシル基がシクロアルキルカルボニル基、アリールカルボニル基、シクロア  
 ルキルオキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルカルボ  
 15 ニル基、アラルキルオキシカルボニル基、5～6員複素環カルボニル基、縮合複素  
 環カルボニル基または5～6員複素環アセチル基の場合、ハロゲンで1～3個置  
 換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケ  
 ニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ハロゲンで1～3個  
 置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ホルミル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカル  
 20 ボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニルカルボニル基、  
 C<sub>3-6</sub>シクロアルキルカルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールカルボニル基、C<sub>1-6</sub>  
 アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>ア  
 ルキニルオキシカルボニル基、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルオキシカルボニル基、  
 C<sub>6-14</sub>アリールオキシカルボニル基、C<sub>7-19</sub>アラルキルカルボニル基、C  
 25 7-19アラルキルオキシカルボニル基、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、  
 シアノ基、スルファモイル基、メルカプト基、ハロゲン原子およびC<sub>1-6</sub>アルキ  
 ルチオ基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよい。）または(5)式  
 -CONR<sup>5a</sup>R<sup>6a</sup>

（式中、R<sup>5a</sup>及びR<sup>6a</sup>はそれぞれ水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-6</sub>シク

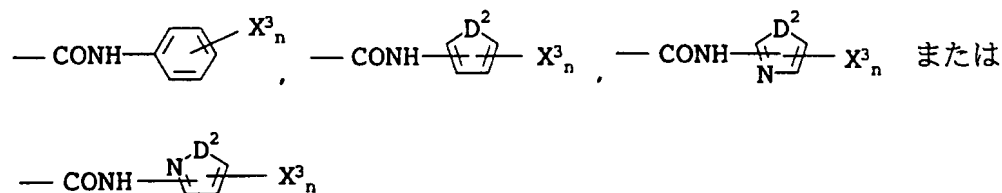
ロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロアルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキ  
ニル基、 $C_{6-14}$ アリール基、 $C_{7-19}$ アラルキル基、 $C_{8-20}$ アリールアルケニル  
基および $C_{8-20}$ アリールアルキニル基から選ばれる炭化水素基（該炭化水素基  
5 置換基群（A）から選ばれる1～4個の置換基で置換されていてもよい。該炭化  
水素基がシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、アラルキル基、  
アリールアルケニル基またはアリールアルキニル基の場合、該炭化水素基は上記  
置換基群（A）から選ばれる置換基、ハロゲンで1～5個置換されていてもよい  
10  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{3-6}$ シクロ  
アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-14}$ アリール基および $C_{7-19}$ アラルキ  
ル基から選ばれる置換基で1～5個置換されていてもよく、隣接する2つの置換  
基が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよい。）を示す。）で表され  
る基を示す請求項1記載の化合物またはその塩。

15 3.  $R^1$ が式



[式中、 $\text{X}^1$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルオキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルチオ基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルチオ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルスルフィニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニルスルフィニル基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニルス

- ルホニル基、 $C_{2-6}$ アルキニルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、アミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、  
 5 または $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基を示すか、隣接する2つの $X^1$ が一緒になってメチレンジオキシ基を形成してもよく、 $m$ は0~3の整数を示し、 $D^1$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d1}$  (式中、 $R^{d1}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される基を示す。]で表される基、または式



- 10 [式中、 $X^3$ は同一または異なってハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、フェノキシ基、ホルムアミド基、 $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、またはニトロ基を、  
 15  $n$ は0~3の整数を、 $D^2$ は酸素原子、硫黄原子、または式 $NR^{d2}$  (式中、 $R^{d2}$ は水素原子、または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される基を示す。]で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

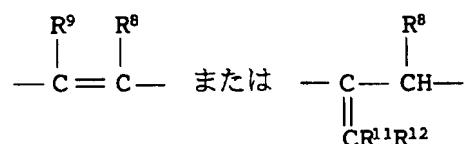
20

4.  $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基である請求項1記載の化合物またはその塩。

5.  $R^4$ が(1)それぞれハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基およびハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アル  
 25

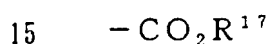
- コキシ基から選ばれる 1～3 個の置換基で置換されていてもよい (i) フェニル基、  
 (ii) ナフチル基または (iii) チエニル基、(2) ハロゲンで 1～3 個置換されてい  
 もよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(3) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{2-6}$   
 アルケニルオキシ基、(4) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{2-6}$  アル  
 5 キニルオキシ基、または (5) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよいフェノキ  
 シ基である請求項 1 記載の化合物またはその塩。

6. -A- が式



- 10 (式中の記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される基である請求項 1 記  
 載の化合物またはその塩。

7. Z がハロゲン原子、シアノ基、ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基、式



[式中、 $R^{17}$  は (i) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基ま  
 たは (2) (i) ハロゲン原子、(ii) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$   
 アルキル基または (iii) ハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコ  
 キシ基で 1～3 個置換されていてもよい  $C_{7-19}$  アラルキル基を示す。]

20 る基、式



[式中、 $R^{17X}$  は水素原子またはハロゲンで 1～3 個置換されていてもよい  $C_{1-6}$   
 アルキル基を示す。]



- 25 [式中、 $R^{5b}$  及び  $R^{6b}$  はそれぞれ水素原子またはハロゲンで 1～3 個置換されて  
 いてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を示す。]

物またはその塩。

8.  $R^8$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基である請求項1記載の化合物またはその塩。

5

9.  $R^9$ が(i)水素原子、(2)(i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ基、(iii) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(iv) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(v) $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(vi) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(vii) $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルオキシ基または(viii)式 $=N-OR^{14}$ [式中、 $R^{14}$ は請求項2記載と同意義を示す。]で表される基で1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、(3) $C_{3-6}$ シクロアルキル基、(4) $C_{2-6}$ アルケニル基、(5) $C_{1-6}$ アルコキシで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、(6)シアノ基、(7)ホルミル基または(8)ヒドロキシ基である請求項1記載の化合物またはその塩。

10

10.  $R^{10}$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基である請求項1記載の化合物またはその塩。

15

11.  $R^{11}$ が水素原子、ハロゲン原子、ハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基または $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基であり、 $R^{12}$ が水素原子、ハロゲン原子またはハロゲンで1~3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基である請求項1記載の化合物またはその塩。

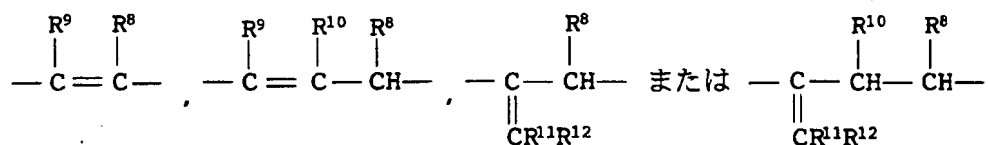
20

12.  $R^{13}$ は(i)ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基もしくは $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基で1~3個置換されていてもよいフェニル基、(2)ナフチル基、(3)ハロゲンで1~3個置換されていてもよいピリジル基、(4)キノリル基、(5)イソキノリル基、(6) $C_{1-4}$ アルキルで1~3個置換されていてもよいキナゾリニル基、(7)ハロゲンで1~3個置換されていてもよいイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル基、(8)ハ

25



ロゲンで1～3個置換されていてもよい1, 4-ベンゾジオキシニル基、(9)ハ  
 ロゲンで1～3個置換されていてもよい2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオ  
 キシニル基、(10)ベンゾフラニル基または(11) (i)ハロゲン、ハロゲンで1～3  
 個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキ  
 5 ニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>  
 アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、ホルムアミド基、C<sub>1-6</sub>  
 アルキル-カルボニルアミノ基およびシアノ基から選ばれる1～3個の置換基で  
 置換されていてもよいフェニル基または(ii) C<sub>1-6</sub>アルキルで1～2個置換され  
 てもよいチアゾリル基で置換されたカルバモイル基を、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれ  
 10 ぞれC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>4</sup>は(i)ハロゲンもしくはC<sub>1-6</sub>アルキル基で1～3  
 個置換されていてもよいフェニル基または(2) C<sub>1-6</sub>アルコキシ基を、-A-は  
 式



(式中、R<sup>8</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を、R<sup>9</sup>は(1)水素原子、(2)ハロ  
 15 ゲン、ヒドロキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アル  
 キルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニ  
 ルオキシ基、ヒドロキシイミノ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシイミノ基もしくはC<sub>1-6</sub>ア  
 ルキル-カルボニルオキシイミノ基で1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アル  
 キル基、(3) C<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、(4) C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(5) C<sub>1-6</sub>アルコ  
 20 キシ基で1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(6)ホルミル基、(7)  
 シアノ基または(8)ヒドロキシ基を、R<sup>10</sup>は水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基  
 を、R<sup>11</sup>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキ  
 ルスルフィニル基またはC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基を、R<sup>12</sup>は水素原子を示す。  
 )で表される基を、Zは(i)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>ア  
 25 ルコキシ-カルボニル基、(2)ハロゲンで1～3個置換されていてもよいC<sub>7-19</sub>  
 アラルキルオキシ-カルボニル基、(3) C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニル基または(4)

モノもしくはジ ( $C_{1-6}$ アルキル) カルバモイル基を示す請求項 1 記載の化合物  
またはその塩。

5 13. メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェニル-2H-ピロール  
-3-カルボキシレートまたはその塩。

10 14. メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-3-カルボキシレート  
またはその塩。

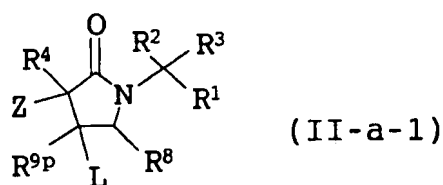
15 15. メチル 1-(1-(N-(2, 5-ジクロロフェニル)カルバモイル)  
-1-メチルエチル)-1, 3-ジヒドロ-4-メチル-2-オキソ-3-フェ  
ニル-2H-ピロール-3-カルボキシレートまたはその塩。

16. メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
-1, 3-ジヒドロ-3-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-2-オキソ  
-2H-ピロール-3-カルボキシレートまたはその塩。

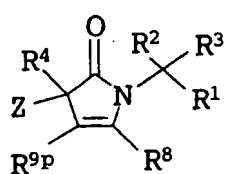
20 17. メチル 1-(1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル)  
-3-(2-フルオロフェニル)-4-メチレン-2-オキソピロリジン-3-  
カルボキシレートまたはその塩。

25 18. メチル 1-(1-(N-(3, 5-ジクロロフェニル)カルバモイル)  
-1-メチルエチル)-4-メチレン-2-オキソ-3-フェニルピロリジン-  
3-カルボキシレートまたはその塩。

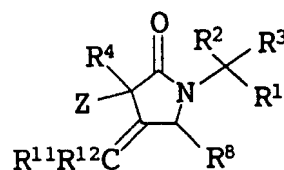
19. (1) 式



(式中、 $R^{9p}$ は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を、Lは脱離基を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を脱離反応に付し、式

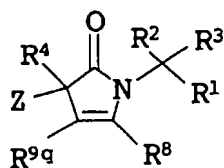


及び/または



5

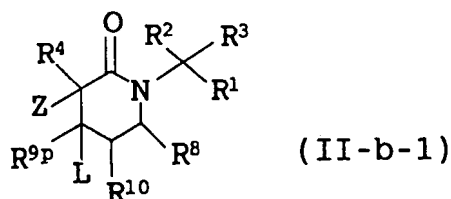
(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-a-1)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させ、式



10

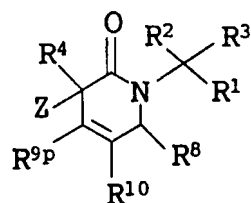
(式中、 $R^{9q}$ は置換されていてもよいアシル基を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(2) 式



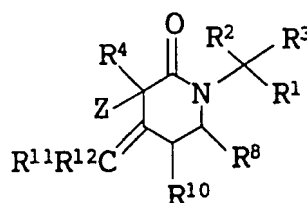
15

(式中、 $R^{9p}$ およびLは前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を脱離反応に付し、式



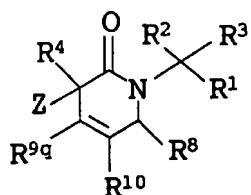
(I-b-1)

及び/または



(I-d)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。  
)で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-b-1)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させ、式

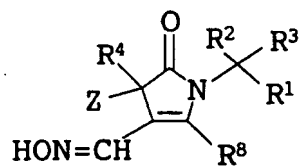


(I-b-2)

5

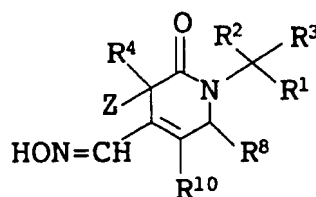
(式中、 $R^{9q}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。  
)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(3) 式



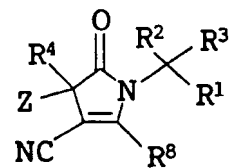
(I-a-1a'')

または



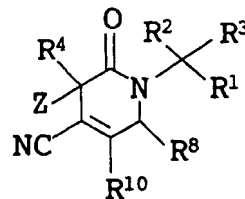
(I-b-1a'')

10 (式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を脱水反応に付し、式



(I-a-4)

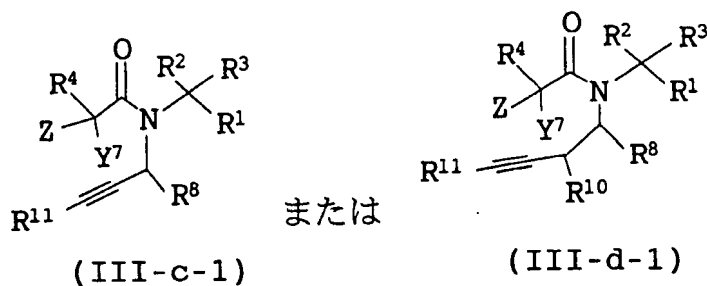
または



(I-b-4)

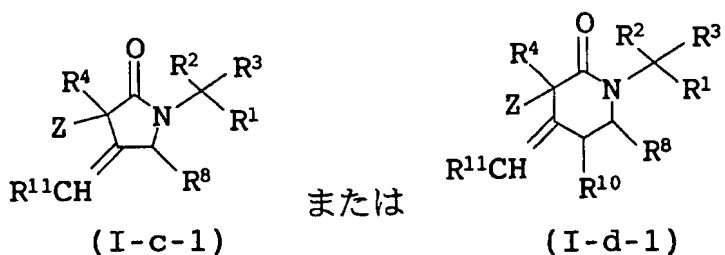
(式中、各記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(4) 式



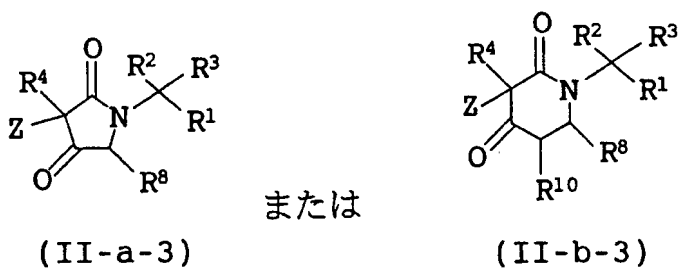
5 (式中、Y<sup>7</sup>はハロゲン原子を、その他の記号は請求項 1 記載と同意義を示す。

) で表される化合物またはその塩を閉環反応に付し、式



(式中、各記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

10 (5) 式

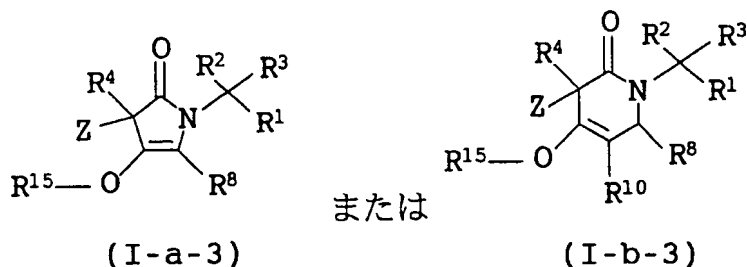


(式中、各記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を式

$R^{15} - L^4$

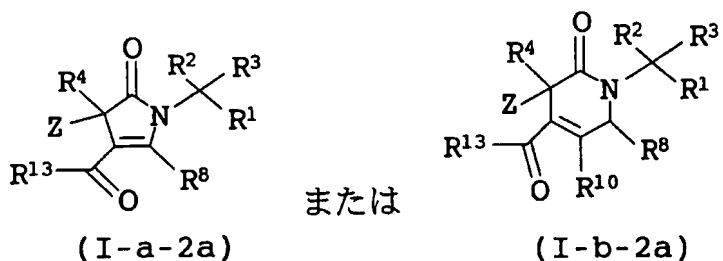
15 (式中、L<sup>4</sup>は脱離基を、R<sup>15</sup>は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化

合物またはその塩と反応させて、式



(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

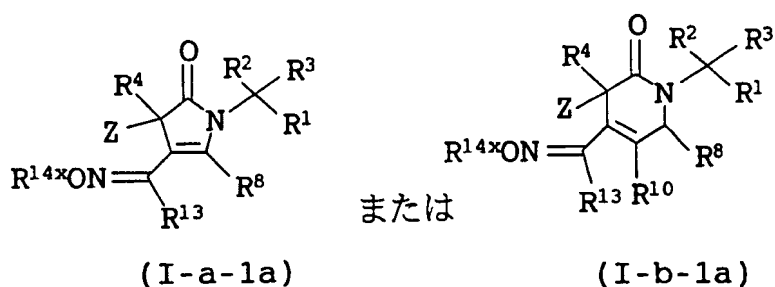
5                      (6) 式



(式中、 $R^{13}$ は水素原子、またはそれぞれハロゲンで1～3個置換されていて  
もよい (i)  $C_{1-6}$ アルキル基、 (ii)  $C_{6-14}$ アリール基もしくは (iii)  $C_{7-11}$   
 $_9$ アラルキル基を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される  
10                      化合物またはその塩を式

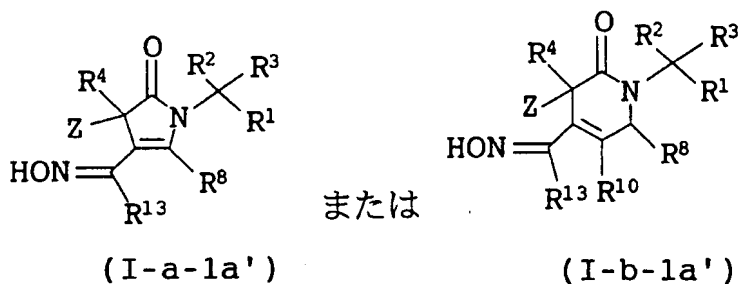


(式中、 $R^{14 \times}$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を示す。) で表される化合物  
またはその塩と反応させて、式



(式中、 $R^{13}$ 及び $R^{14*}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(7) 式

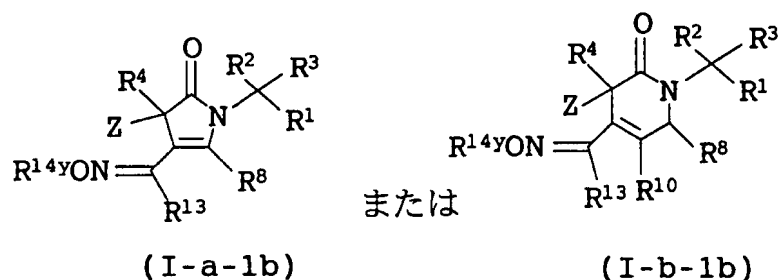


- 5      (式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。  
 ) で表される化合物またはその塩を式

$R^{14y} - L^2$

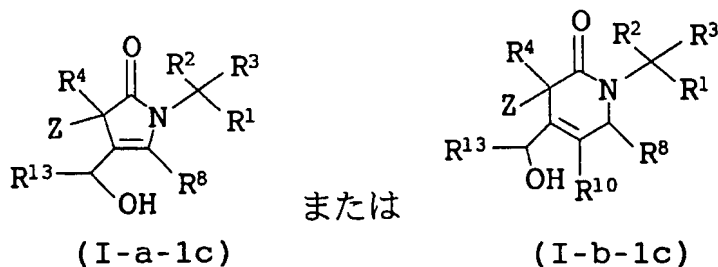
(式中、 $R^{14y}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を、 $L^2$ は脱離基を示す。) で表される化合物またはその塩と反応さ

- 10      せて、式



(式中、 $R^{13}$ 及び $R^{14y}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

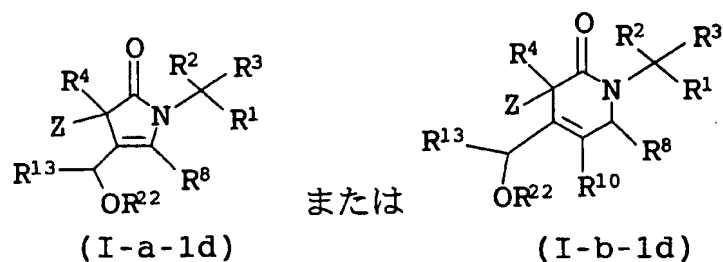
- (8) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物または  
 15      はその塩を還元剤と反応させて、式



(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。  
)で表される化合物またはその塩を製造し、所望により上記式(I-a-1c)または  
(I-b-1c)で表される化合物またはその塩を式

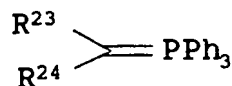
5  $R^{22}-L^6$

(式中、 $R^{22}$ はそれぞれハロゲンで1～3個置換されていてもよい(i)  $C_{1-6}$   
アルキル基または(ii)  $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基を、 $L^6$ は脱離基を示す。  
)で表される化合物またはその塩と反応させて、式



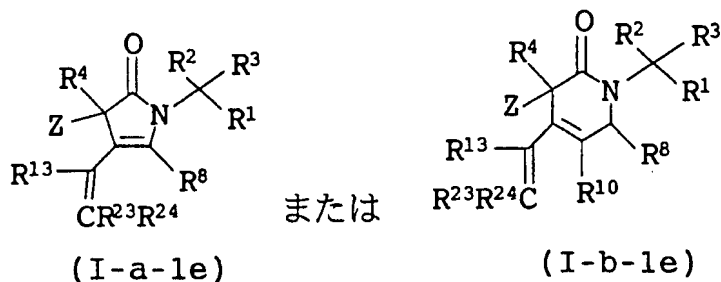
10 (式中、 $R^{13}$ 及び $R^{22}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(9) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物またはその塩を式



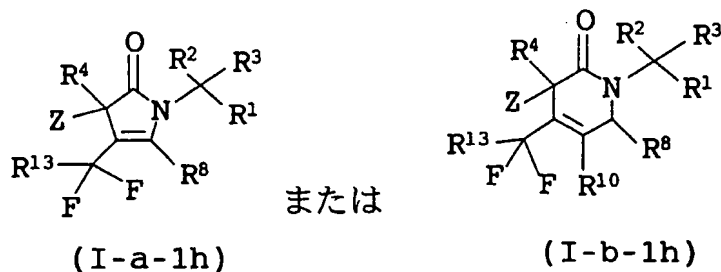
15 (式中、 $R^{23}$ 及び $R^{24}$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル基または $C_{1-6}$ アルコキシ基を、Phはフェニル基を示す。)で表される化合物またはその塩と反応させて、式





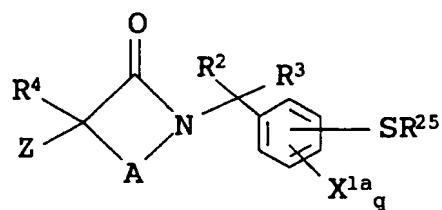
(式中、 $R^{13}$ 、 $R^{23}$ 及び $R^{24}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(10) 上記(6)に記載の式(I-a-2a)または(I-b-2a)で表される化合物またはその塩をフッ素化剤と反応させて、式



(式中、 $R^{13}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(11) 式

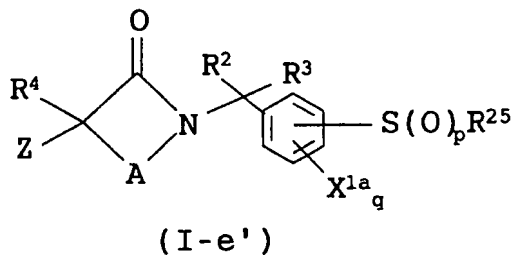


(I-e)

10

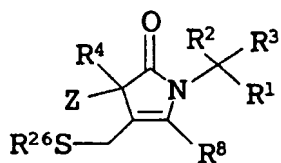
(式中、 $R^{25}$ はハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基またはフェニル基を、 $q$ は0～2の整数を、 $X^{1a}$ は同一または異なってハロゲン原子またはハロゲンで1～3個置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式



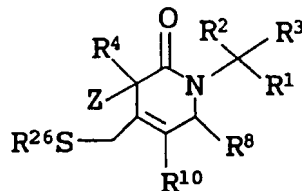
(式中、pは1または2を、 $R^{25}$ 、 $X^{1a}$ 及びqは前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(12)式



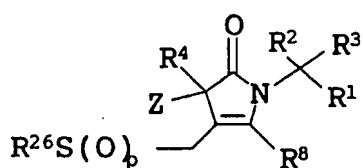
(I-a-1f)

または



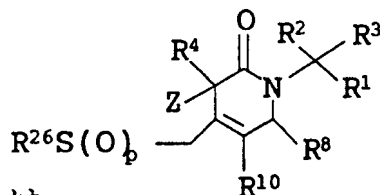
(I-b-1f)

(式中、 $R^{26}$ は $C_{1-6}$ アルキル基を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式



(I-a-1g)

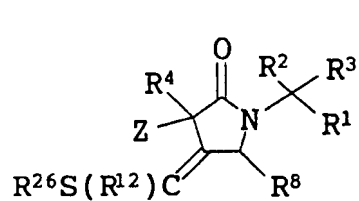
または



(I-b-1g)

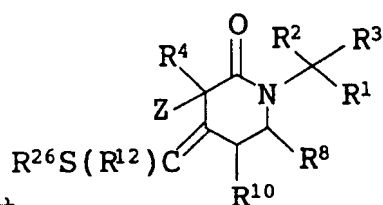
(式中、 $R^{26}$ 及びpは前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、

(13)式



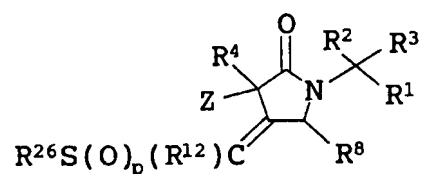
(I-c-2)

または



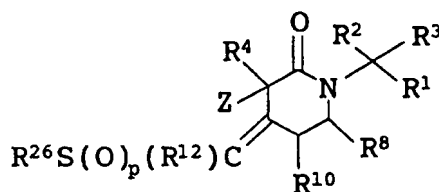
(I-d-2)

(式中、 $R^{26}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。  
)で表される化合物またはその塩を酸化剤と反応させて、式



(I-c-3)

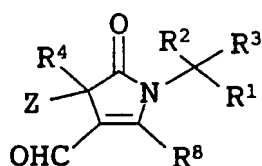
または



(I-d-3)

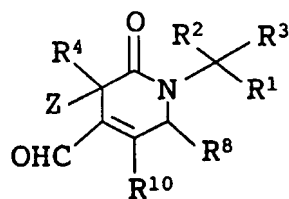
5

(式中、 $R^{26}$ 及び $p$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を製造するか、  
(14)式



(I-a-2a')

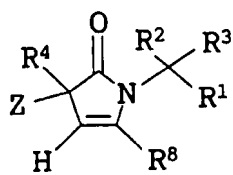
または



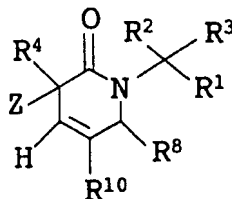
(I-b-2a')

10

(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩を有機ロジウム錯体と反応させて、式



または

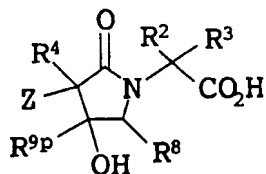


(I-a-1i)

(I-b-1i)

(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩を製造するか、

(15) 式



(II'-a-1)

5

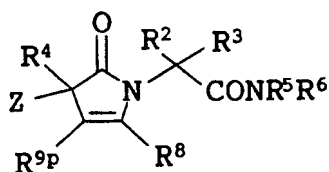
(式中、R<sup>9p</sup>は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

) で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、式

HNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>

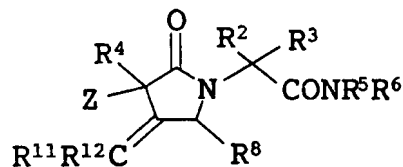
(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその

10 塩と反応させて、式



(I-a-1r)

及び/または



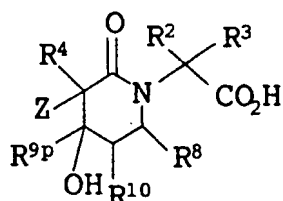
(I-c-r)

(式中、R<sup>9p</sup>は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

) で表される化合物またはその塩を製造するか、

15

(16) 式



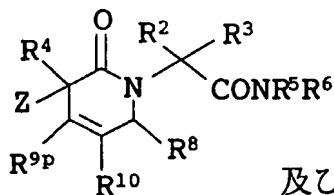
(II'-b-1)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

)で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、式

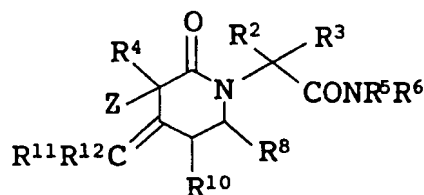


- 5 (式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩と反応させて、式



(I-b-1r)

及び/または

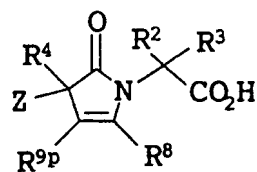


(I-d-r)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

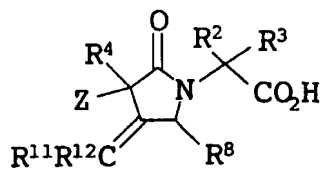
)で表される化合物またはその塩を製造するか、

- 10 (17) 式



(I'-a-1)

または



(I'-c-1)

(式中、 $R^{9p}$ は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

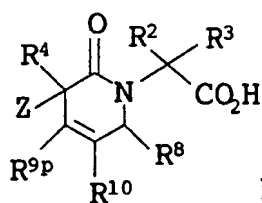
)で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、得られる酸ハロゲン化物と、式

- 15  $HNR^5R^6$

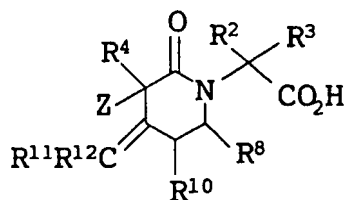
(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。)で表される化合物またはその塩とを反応させて、上記(15)に記載の式(I-a-1r)または(I-c-r)で表さ

れる化合物またはその塩を製造するか、または

(18) 式



または



(I'-b-1)

(I'-d-1)

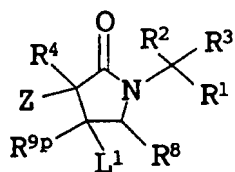
(式中、R<sup>9p</sup>は前記と同意義を、その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。

- 5 ) で表される化合物またはその塩をハロゲン化剤と反応させた後、得られる酸ハロゲン化物と、式

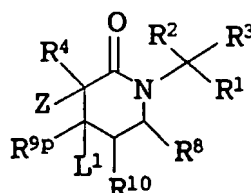


(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩とを反応させて、上記(16)に記載の式(I-b-1r)または(I-d-r)で表される化合物またはその塩を製造することを特徴とする請求項1記載の化合物またはその塩の製造法。

20. 式



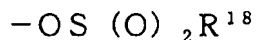
または



(II-a-1x)

(II-b-1x)

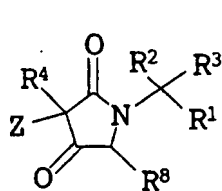
- 15 (式中、R<sup>9p</sup>は請求項19記載と同意義を、L<sup>1</sup>はハロゲン原子、ヒドロキシ基、  
-OS(O)Clまたは式



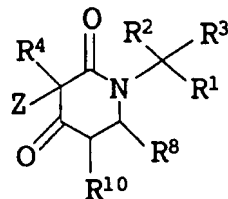
(式中、R<sup>18</sup>は置換されていてもよい炭化水素基を示す。) で表される基を、  
その他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩。

20

21. 式



または

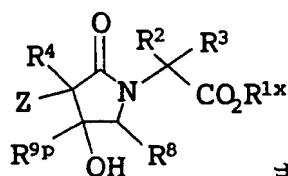


(II-a-3)

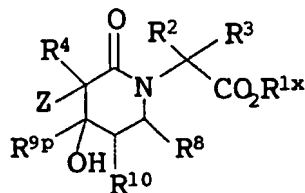
(II-b-3)

(式中、各記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩。

## 5 2 2. 式



または



(II'-a)

(II'-b)

(式中、 $R^{1x}$ は水素原子、ベンジル基またはtert-ブチル基を、 $R^{9p}$ は請求項 1 9 記載と同意義を、その他の記号は請求項 1 記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩。

## 10

2 3. 請求項 1 記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする除草剤。

2 4. 水田用除草剤である請求項 2 3 記載の除草剤。

15 2 5. 請求項 1 記載の化合物の除草剤としての使用。

2 6. 請求項 1 記載の化合物またはその塩を水田に施用することを特徴とする水田雑草の除草方法。

27. 請求項1記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする水面浮遊性粒剤。

5 28. さらに結合剤、界面活性剤及び比重が1以下の粉末基剤を含有することを特徴とする請求項27記載の水面浮遊性粒剤。

29. 結合剤が、カルボキシメチルセルロースまたはその塩及びポリカルボン酸系高分子化合物またはその塩から選ばれる1種以上である請求項28記載の水面浮遊性粒剤。

10

30. 界面活性剤が、アルキルスルホサクシネートまたはアセチレングリコール系界面活性剤より選ばれる1種以上である請求項28記載の水面浮遊性粒剤。

15 31. 比重が1以下の粉末基剤が、パーライトである請求項28記載の水面浮遊性粒剤。

32. さらに有機溶剤を含有することを特徴とする請求項27記載の水面浮遊性粒剤。

20 33. 有機溶剤が、メチルナフタレンである請求項32記載の水面浮遊性粒剤。

34. さらに他の除草活性成分を含有することを特徴とする請求項27記載の水面浮遊性粒剤。

25 35. 他の除草活性成分がイマゾスルフロンの請求項34記載の水面浮遊性粒剤。

36. 20ないし200g単位で水溶性フィルムで包装した請求項27記載の水面浮遊性粒剤。



37. 請求項1記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする水性懸濁剤。

5      38. さらに界面活性剤を含有することを特徴とする請求項37記載の水性懸濁剤。

39. 界面活性剤が、アルキルスルホサクシネート及びポリオキシエチレンアル  
10      キルアリールリン酸エステル塩から選ばれる1種以上である請求項38記載の水  
性懸濁剤。

40. さらに他の除草活性成分を含有することを特徴とする請求項37記載の水  
性懸濁剤。

15      41. 他の除草活性成分がイマゾスルフロンである請求項40記載の水性懸濁剤。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/04327

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.<sup>6</sup> C07D207/36, C07D207/38, C07D211/90, C07D401/06,  
C07D405/06, C07D471/04, A01N43/36, A01N43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.<sup>6</sup> C07D207/36, C07D207/38, C07D211/90, C07D401/06,  
C07D405/06, C07D471/04, A01N43/36, A01N43/40

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Boivin, Jean et al., "A versatile radical based synthesis of $\gamma$ -lactams using nickel powder/acetic acid", Tetrahedron Lett. (1994), 35(31), 5629-32	1-3, 6-8, 11, 19 4, 5, 9, 10, 12-18, 20-41
X A	Baussanne, Isabelle et al., "Diastereoselective bis-alkylation of chiral non-racemic $\alpha$ , $\beta$ -unsaturated $\gamma$ -lactams", Tetrahedron Lett. (1994), 35(23), 3931-4	1-3, 6-9 4, 5, 10-41
X A	Deshayes, Christian et al., "Synthesis of some 2-amino-4-carboxy-3, 4-dihydro-2H-1-benzopyran lactams from 4-hydroxy-5-oxo-4, 5-dihydropyrrole derivatives", Synthesis (1981), (6), 466-8	1-3, 5, 6, 8 2-4, 7, 9-41
X A	Vernon, John M. et al., "Oxidation of enamine esters with lead tetraacetate. Part 2. Products from N-aryl- and N-benzyl aminofumarates", J. Chem. Res., Synop. (1982), (5), 115	1-3, 6, 7 2-5, 8-41
X A	US, 2984672, A (Newman M. Bornick et al.), 16 May 1961 (16.05.61), (Family: none)	1-3, 6-9 4, 5, 10-41

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:  
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  
"E" earlier document but published on or after the international filing date  
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone  
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art  
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
15 November, 1999 (15.11.99)

Date of mailing of the international search report  
24 November, 1999 (24.11.99)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/04327

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Cave, Christian et al., "Condensation of chiral imines and chiral $\beta$ -enamino esters with maleic and citraconic anhydride", Tetrahedron Lett. (1997), 38(27), 4773-4776	1-3,6,8 4,5,7,9-41
X A	Desmaeele, Didier et al., "Stereocontrolled Elaboration of Quaternary Carbon Centers through the Asymmetric Michael-Type Alkylation of Chiral Imines/Secondary Enamines: Enantioselective Synthesis of (+)-Vincamine", J. Org. Chem. (1997), 62(12), 3890-3901	1,2,7-10,20,21 3-6,11-19, 22-41
X A	Mekouar, Khalid et al., "Enantioselective approaches to Vinca alkaloids through the asymmetric Michael reaction using chiral imines", Synlett (1995), (Spec. Issue), 529-532	1,2,7-10,20,21 3-6,11-19, 22-41
X A	Meyers, A. I. et al., "The asymmetric synthesis of 2, 2-dialkyl carboxylic esters and 2, 2-disubstituted dihydronaphthalenes", J. Org. Chem. (1990), 55(10), 3137-43	1,2,6-9 3-5,10-41
X A	Bertrand, M. T. et al., "Addition reaction of the zinc derivative of ethyl methylbromocyanoacetate on true acetylenic carbides and propargylic compounds", Tetrahedron Lett. (1975), (36), 3147-50	1,2,6-11 3-5,12-41
X A	Naito, Takeaki et al., "Photocyclization of enamides. XXXVI. Alkaloid synthesis using furopyridone as a synthon: synthesis of key intermediates for the synthesis of eburnamine-vincamine alkaloids", Chem. Pharm. Bull. (1992), 40(3), 602-8	1,2,8-11 3-7,12-41
X A	Caballero, Esther et al., "N-Substituted pyrrolinones from enamines and $\alpha$ -dicarbonyls", Tetrahedron (1994), 50(26), 7849-56	1,2,5-8 3,4,9-41
X A	Bertrand, Marie T. et al., "Addition reaction of the organozinc derivative of ethyl methylbromomalonate to $\beta$ -acetylenic compounds. Applications to the synthesis of lactones and lactams", C. R. Hebd. Seances Acad. Sci., Ser. C (1975), 280(15), 999-1002	1,2,7,8,10,11 3-6,9,12-41
X A	Hurley, Timothy R. et al., "Photodecomposition of CI-981, and HMG-CoA reductase inhibitor", Tetrahedron (1993), 49(10), 1979-84	1,2,6 3-5,7-41
X A	Soti, Ferenc et al., "Synthesis of vinca alkaloids and related compounds. LV. Synthesis of (.+-.)-desmethoxy cuanzine", Tetrahedron (1991), 47(2), 271-96	20 1-19,21-41
X A	JP, 54-020503, A (), 23 July, 1979 (23.07.79) & US, 3764606, A & DE, 2027077, A & FR, 2052930, A1 & GB, 1299670, A	21 1-20,22-41

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/04327

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Micovic, Ivan V. et al., "The synthesis of lactam analogs of fentanyl", J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 (1996), (16), 2041-2050	21 1-20,22-41
X A	Ambroise, Lydia et al., "The use of 3-alkyl-2, 4- diketopiperidines in asymmetric Michael additions", Tetrahedron: Asymmetry (1991), 2(6), 407-10	21 1-20,22-41
X A	Bosch, Joan et al., "Studies on the synthesis of the benzo [a]quinolizidin-2-one ring system. Preparation of a 1, 1-dimethyl derivative", J. Org. Chem. (1983), 48(7), 1075-80	21 1-20,22-41
X A	Yamamoto, Ikuo et al., "Central effects of N-allyl-N'-methylbarbital and N-allylmethypylon in mice", Res. Commun. Chem. Pathol. Pharmacol. (1986), 54(2), 191-9	21 1-20,22-41

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>6</sup> C07D207/36, C07D207/38, C07D211/90, C07D401/06,  
C07D405/06, C07D471/04, A01N43/36, A01N43/40

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>6</sup> C07D207/36, C07D207/38, C07D211/90, C07D401/06,  
C07D405/06, C07D471/04, A01N43/36, A01N43/40

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	Boivin, Jean et al., "A versatile radical based synthesis of $\gamma$ -lactams using nickel powder/acetic acid", Tetrahedron Lett. (1994), 35(31), 5629-32	1-3, 6-8, 11, 19 4, 5, 9, 10, 12-18, 20-41
X A	Baussanne, Isabelle et al., "Diastereoselective bis-alkylation of chiral non-racemic $\alpha, \beta$ -unsaturated $\gamma$ -lactams", Tetrahedron Lett. (1994), 35(23), 3931-4	1-3, 6-9 4, 5, 10-41
X A	Deshayes, Christian et al., "Synthesis of some 2-amino-4-carboxy-3,4-dihydro-2H-1-benzopyran lactams from 4-hydroxy-5-oxo-4,5-dihydropyrrole derivatives", Synthesis (1981), (6), 466-8	1-3, 5, 6, 8 2-4, 7, 9-41

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

15. 11. 99

国際調査報告の発送日

24.11.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

中木 亜希

3  
果

4 P 9638

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

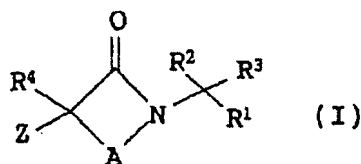
C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	Vernon, John M. et al., "Oxidation of enamine esters with lead tetraacetate. Part 2. Products from N-aryl- and N-benzyl aminofumarates", J. Chem. Res., Synop. (1982), (5), 115	1-3, 6, 7 2-5, 8-41
X A	US, 2984672, A (Newman M. Bornick et al.) 16. 5月. 1961 (16. 05. 61) (ファミリーなし)	1-3, 6-9 4, 5, 10-41
X A	Cave, Christian et al., "Condensation of chiral imines and chiral $\beta$ -enamino esters with maleic and citraconic anhydride", Tetrahedron Lett. (1997), 38(27), 4773-4776	1-3, 6, 8 4, 5, 7, 9-41
X A	Desmaeele, Didier et al., "Stereocontrolled Elaboration of Quaternary Carbon Centers through the Asymmetric Michael-Type Alkylation of Chiral Imines/Secondary Enamines: Enantioselective Synthesis of (+)-Vincamine", J. Org. Chem. (1997), 62(12), 3890-3901	1, 2, 7-10, 20, 21 3-6, 11-19, 22-41
X A	Mekouar, Khalid et al., "Enantioselective approaches to Vinca alkaloids through the asymmetric Michael reaction using chiral imines", Synlett (1995), (Spec. Issue), 529-532	1, 2, 7-10, 20, 21 3-6, 11-19, 22-41
X A	Meyers, A. I. et al., "The asymmetric synthesis of 2,2-dialkyl carboxylic esters and 2,2-disubstituted dihydronaphthalenes", J. Org. Chem. (1990), 55(10), 3137-43	1, 2, 6-9 3-5, 10-41
X A	Bertrand, M. T. et al., "Addition reaction of the zinc derivative of ethyl methylbromocyanoacetate on true acetylenic carbides and propargylic compounds", Tetrahedron Lett. (1975), (36), 3147-50	1, 2, 6-11 3-5, 12-41
X A	Naito, Takeaki et al., "Photocyclization of enamides. XXXVI. Alkaloid synthesis using furopyridone as a synthon: synthesis of key intermediates for the synthesis of eburnamine-vincamine alkaloids", Chem. Pharm. Bull. (1992), 40(3), 602-8	1, 2, 8-11 3-7, 12-41
X A	Caballero, Esther et al., "N-Substituted pyrrolinones from enamines and $\alpha$ -dicarbonyls", Tetrahedron (1994), 50(26), 7849-56	1, 2, 5-8 3, 4, 9-41
X A	Bertrand, Marie T. et al., "Addition reaction of the organozinc derivative of ethyl methylbromomalonate to $\beta$ -acetylenic compounds. Applications to the synthesis of lactones and lactams", C. R. Hebd. Seances Acad. Sci., Ser. C (1975), 280(15), 999-1002	1, 2, 7, 8, 10, 11 3-6, 9, 12-41
X A	Hurley, Timothy R. et al., "Photodecomposition of CI-981, and HMG-CoA reductase inhibitor", Tetrahedron (1993), 49(10), 1979-84	1, 2, 6 3-5, 7-41
X A	Soti, Ferenc et al., "Synthesis of vinca alkaloids and related compounds. LV. Synthesis of (+, -)-desmethoxy cuanzine", Tetrahedron (1991), 47(2), 271-96	20 1-19, 21-41
X A	JP, 54-020503, A () 23. 7. 1979 (23. 07. 79) &US, 3764606, A &DE, 2027077, A &FR, 2052930, A1 &GB, 1299670, A	21 1-20, 22-41

## 《C欄の続き》

引用文献の カテゴリー	引用文献名	関連する 請求の範囲の番号
X A	Micovic, Ivan V. et al., "The synthesis of lactam analogs of fentanyl", J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 (1996), (16), 2041-2050	21 1-20, 22-41
X A	Ambroise, Lydia et al., "The use of 3-alkyl-2,4-diketopiperidines in asymmetric Michael additions", Tetrahedron: Asymmetry (1991), 2(6), 407-10	21 1-20, 22-41
X A	Bosch, Joan et al., "Studies on the synthesis of the benzo[a]quinolizidin-2-one ring system. Preparation of a 1,1-dimethyl derivative", J. Org. Chem. (1983), 48(7), 1075-80	21 1-20, 22-41
X A	Yamamoto, Ikuo et al., "Central effects of N-allyl-N'-methylbarbital and N-allylmethyprylon in mice", Res. Commun. Chem. Pathol. Pharmacol. (1986), 54(2), 191-9	21 1-20, 22-41

**Patent Claims**

1. A compound or salts thereof represented by general formula



[wherein, R1 denotes optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted heterocyclic group or group denoted by formula

-CONR5R6

(wherein, R5 and R6 each independently denote hydrogen atom, optionally substituted hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group),

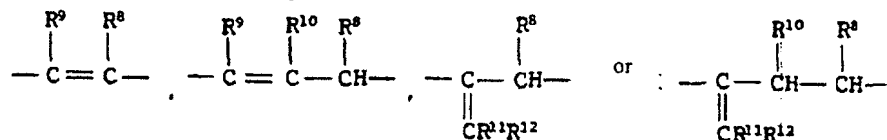
R2 and R3 each independently denote hydrogen atom or optionally substituted hydrocarbon group, or R2 and R3 together with the adjacent carbon atom, may form optionally substituted 3-8 membered cyclic hydrocarbon group,

R4 denotes optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted heterocyclic group or group denoted by formula

-W1R7

(wherein, W1 denotes an oxygen atom or the sulfur atom which may be oxidized, and R7 denotes optionally substituted hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group),

-A- denotes a group represented by formula



(wherein R8 denotes hydrogen atom or optionally substituted hydrocarbon group, R9 denotes hydrogen atom, cyano group, optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted heterocyclic group, optionally substituted acyl group, or group represented by formula -OR15

(wherein, R15 denotes a hydrogen atom, optionally substituted hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group),

R10 denotes a hydrogen atom or optionally substituted hydrocarbon group,

R11 denotes a hydrogen atom, halogen atom, optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted heterocyclic group or group represented by formula

-W2R16

(wherein, W2 denotes an oxygen atom or the sulfur atom which may be oxidized, and R16 denotes a hydrogen atom, optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted heterocyclic group or optionally substituted acyl group),

R12 denotes a hydrogen atom, halogen atom or optionally substituted hydrocarbon group,



wherein, the carbon atom that R8 is bonded to form a bond to the nitrogen atom of amide, and the carbon atom that R9 or =CR11R12 is bonded to form a bond with the carbon atom that Z is bonded to),

Z denotes a halogen atom, cyano group, optionally substituted hydrocarbon group, optionally substituted acyl group or group represented by formula

-CONR5aR6a

(wherein, R5a and R6a respectively denote a hydrogen atom or optionally substituted hydrocarbon group)].

2. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein

R1 denotes a group represented by the following [1]-[3];

[1] a hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group {when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, the said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the following (1)-(22);

(1) hydroxy group,

(2) amino group,

(3) cyano group,

(4) sulphamoyl group,

(5) sulphamoyloxy group,

(6) mercapto group,

(7) nitro group,

(8) halogen atom,

(9) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl

group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised),

(10) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group, and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group),

(11) a group represented by formula -T-Q0

[wherein, Q0 denotes

(a) hydrocarbon group selected from the following (i)-(ix) which may be substituted by 1-5 halogens; (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group;

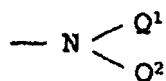
(b) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or

(c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl

group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group), and T denotes -S(O)<sub>k</sub>- (k denotes 0, 1 or 2) or S-S],

(12) a group represented by formula



[wherein, Q<sup>1</sup> denotes (a) hydrogen atom,

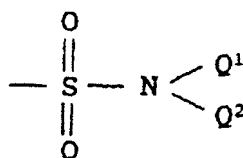
(b) hydrocarbon group selected from the following (i)-(ix) which may be substituted by 1-5 halogens; (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group, or

(c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C

cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group), and Q2 denotes (a) hydrocarbon group selected from the following (i)-(ix) which may be substituted by 1-5 halogens; (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group, or (b) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group, and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group), or Q1 and Q2 together with adjacent nitrogen atom, may form 3-7 membered ring],

(13) a group represented by formula



(wherein, the symbols in the formula have the same aforesaid definitions),

(14) carbamoyl group which may be mono- or di-substituted by

(a) hydrocarbon group selected from the (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group,

(b) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphonamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or

(c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphonamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group),

(15) carbamoyloxy group which may be mono- or di-substituted by

(a) hydrocarbon group selected from the (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group, (b) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or

(c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxycarbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphonamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphonamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group),

(16) ureide group which may be mono- or di-substituted by

(a) hydrocarbon group selected from the (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group, (b) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl



group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-1-6C alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphonamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or

(c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxycarbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphonamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group, and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphonamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group),

(17) thiocarbamoyl group which may be mono- or di-substituted by

(a) hydrocarbon group selected from the (i) 1-6C alkyl group, (ii) 3-6C cycloalkyl group, (iii) 2-6C alkenyl group, (iv) 3-6C cycloalkenyl group, (v) 2-6C alkynyl group, (vi) 6-14C aryl group, (vii) 7-19C aralkyl group, (viii) 8-20C aryl alkenyl group and (ix) 8-20C aryl alkynyl group, (b) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or (c) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group),

(18) carboxyl group,

(19) a group represented by formula -O-SO<sub>2</sub>-Q<sub>2</sub> (wherein, Q<sub>2</sub> has the same aforesaid meaning),

(20) sulfo group,

(21) a group represented by formula =N-OR<sub>14</sub> (wherein, R<sub>14</sub> denotes hydrogen atom, 1-6C alkyl group or 1-6C alkyl-carbonyl group which may be mono- to tri-substituted by halogen),

(22) group comprising 3-6C cycloalkyl group (hereinafter the substituent group (A)); and when aforesaid hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and two adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group};

[2] 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3

halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised); or

[3] formula -CONR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>

[wherein, R<sub>5</sub> and R<sub>6</sub> respectively denote a group represented by (1) hydrogen atom, (2) hydrocarbon group selected from the 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and may form methylenedioxy group together with adjacent 2 substituents) or (3) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-

carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised)]:

R2 and R3 respectively denote hydrogen atom or hydrocarbon group selected from the 1-6C alkyl group 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and may form methylenedioxy group together with adjacent 2 substituents), or R2 and R3 together with adjacent nitrogen atom, may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulfinyl group, 6-14C aryl sulphinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynylthio group and 6-14C arylthio group, or two adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group, or may form 3-8 membered cyclic hydrocarbon group:

R4 denotes (1) hydrocarbon group selected from the 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and 2 adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group),

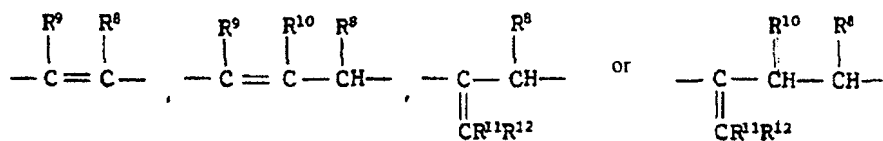
(2) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) or

(3) group represented by formula -W1R7 [wherein, W1 denotes oxygen atom or sulfur atom which may be mono- or di-oxidised, and R7 denotes (1) hydrocarbon group selected from the 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said

hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and 2 adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group), or

(2) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised)]:

- A- denotes



{wherein, R8 is hydrogen atom or hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, the said hydrocarbon group

may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, the said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group which may be substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and two adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group):

R9 denotes (1) hydrogen atom, (2) cyano group, (3) hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents link together, may form methylenedioxy group),

(4) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8



membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised),

(5) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxycarbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group,

and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group), or

(6) group represented by formula -OR<sub>15</sub> [wherein, R<sub>15</sub> denotes (i) hydrogen atom, (ii) hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents link together, may form methylenedioxy group), or (iii) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen

atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised)]:

R10 denotes hydrogen atom or hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, the said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, the said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group which may be substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and two adjacent substituents link together, may form methylenedioxy group):

R11 denotes (1) hydrogen atom, (2) halogen atom, (3) hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group,

aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents link together, may form methylenedioxy group),

(4) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised), or

(5) group represented by formula -W2R16 [wherein, W2 denotes an oxygen atom or optionally mono- or di-oxidised sulfur atom, and R16 denotes (i) hydrogen atom, (ii) hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent

2 substituents link together, may form methylenedioxy group), (iii) 3-8 membered heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms selected from the oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) and nitrogen atom (it may be oxidised) which may be substituted by 1-3 substituents selected from the group comprising 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyloxy group, 2-6C alkynyl oxy group, 6-14C aryloxy group, 7-19C aralkyloxy group, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 1-6C alkyl sulphinyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphinyl group, 2-6C alkynyl sulphinyl group, 6-14C arylsulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl sulphonyl group, 2-6C alkynyl sulphonyl group, 6-14C aryl sulphonyl group, nitro group, amino group, mono- or di-C1-6 alkylamino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyl oxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl thio group, 2-6C alkynyl thio group and 6-14C arylthio group, or in which adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group; or condensed ring group of 3-8 membered heterocycle containing 1-4 heteroatoms selected from the said 3-8 membered heterocyclic group and benzene ring or nitrogen atom (it may be oxidised), oxygen atom and sulfur atom (it may be mono- or di-oxidised) or (iv) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxy carbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group, and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl

group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group)]:

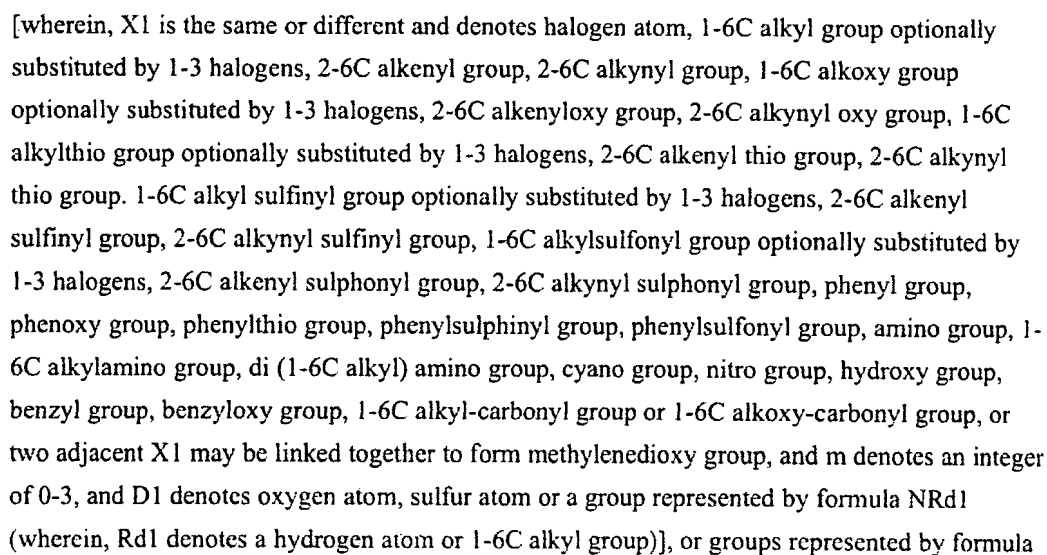
R12 denotes hydrogen atom, halogen atom or hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 5-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents link together, may form methylenedioxy group),

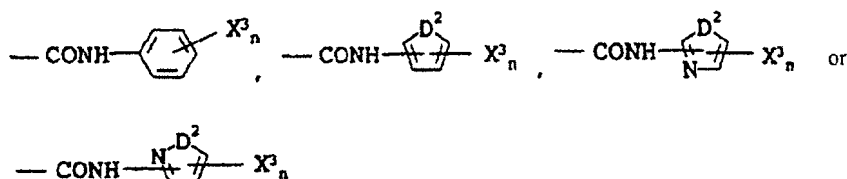
wherein, the carbon atom that R8 is bonded to form a bond to the nitrogen atom of amide, and the carbon atom that R9 or =CR11R12 is bonded to form a bond with the carbon atom that Z is bonded to}:

Z denotes (1) halogen atom, (2) cyano group, (3) hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents link together, may form methylenedioxy group), (4) acyl group selected from the formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C

aralkyloxy-carbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group and 5-6 membered heterocyclic acetyl group (when said acyl group is alkyl carbonyl group, alkenyl carbonyl group, alkynyl carbonyl group, alkoxycarbonyl group, alkenyl oxycarbonyl group or alkynyl oxycarbonyl group, it may be substituted by 1-3 substituents selected from the hydroxy, cyanogen, sulphamoyl, mercapto, carboxy, 1-6C alkylthio group, halogen atom, 1-6C alkoxy group, nitro group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, amino, mono or di 1-6C alkylamino group, 1-6C alkoxyimino group and hydroxyimino group, and when the said acyl group is cycloalkyl carbonyl group, aryl carbonyl group, cycloalkyl oxycarbonyl group, aryl oxycarbonyl group, aralkyl carbonyl group, aralkyl oxycarbonyl group, 5-6 membered heterocyclic carbonyl group, fused heterocyclic carbonyl group or 5-6 membered heterocyclic acetyl group, it may be substituted by 1-5 substituents selected from the 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, formyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 2-6C alkenyl-carbonyl group, 2-6C alkynyl-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl-carbonyl group, 6-14C aryl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, 2-6C alkenyloxy-carbonyl group, 2-6C alkynyl oxy-carbonyl group, 3-6C cycloalkyl oxy-carbonyl group, 6-14C aryloxy-carbonyl group, 7-19C aralkyl-carbonyl group, 7-19C aralkyloxy-carbonyl group nitro group, amino group, hydroxy group, cyano group, sulphamoyl group, mercapto group, halogen atom and 1-6C alkylthio group) or (5) formula -CONR<sup>5a</sup>R<sup>6a</sup> [R<sup>5a</sup> and R<sup>6a</sup> respectively denote hydrogen atom or hydrocarbon group selected from 1-6C alkyl group, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group, 7-19C aralkyl group, 8-20C aryl alkenyl group and 8-20C aryl alkynyl group (when said hydrocarbon group is alkyl group, alkenyl group or alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-4 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), and when said hydrocarbon group is cycloalkyl group, cycloalkenyl group, aryl group, aralkyl group, aryl alkenyl group or aryl alkynyl group, said hydrocarbon group may be substituted by 1-5 substituents selected from the aforesaid substituent group (A), 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-5 halogens, 3-6C cycloalkyl group, 2-6C alkenyl group, 3-6C cycloalkenyl group, 2-6C alkynyl group, 6-14C aryl group and 7-19C aralkyl group, and adjacent 2 substituents may link together to form methylenedioxy group)].

3. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>1</sup> denotes groups represented by formula





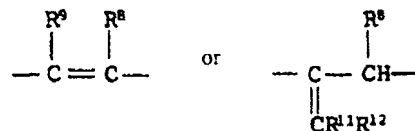
[wherein, X<sup>3</sup> is the same or different, and denotes halogen atom, 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 1-6C alkyl sulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group, 1-6C alkyl-carbonyl group, 1-6C alkoxy-carbonyl group, phenoxy group, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group, 1-6C alkylsulfonyloxy group, cyano group or nitro group, and n denotes an integer of 0-3, D<sup>2</sup> is oxygen atom, sulfur atom or formula NR<sup>d2</sup> (wherein, R<sup>d2</sup> denotes a hydrogen atom or 1-6C alkyl group)].

4. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are each 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens.

5. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>4</sup> is

- (1) (i) phenyl group, (ii) naphthyl group or (iii) thienyl group, each of which may be substituted with 1-3 substituents selected from halogen atom, 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens and 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens,
- (2) 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens,
- (3) 2-6C alkenyloxy group optionally substituted by 1-3 halogens,
- (4) 2-6C alkynyloxy group optionally substituted by 1-3 halogens, or
- (5) phenoxy group optionally substituted by 1-3 halogens.

6. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein -A- is group represented by formula



(in the formula notation has the same aforesaid meaning as the description in Claim 1).

7. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein Z is halogen atom, cyano group, 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, a group represented by formula -CO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>

(wherein, R<sup>17</sup> denotes (1) 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, or (2) 7-19C aralkyl group optionally substituted by (i) halogen atom, (ii) 1-6C alkyl group optionally



substituted by 1-3 halogens, or (iii) 7-19C aralkyl group which may be mono- to tri-substituted by 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 halogens), a group represented by formula -COR<sup>17</sup>X

(wherein, R<sup>17</sup>X denotes hydrogen atom or 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens), or a group represented by formula -CONR<sup>5b</sup>R<sup>6b</sup>

(wherein, R<sup>5b</sup> and R<sup>6b</sup> respectively denote a hydrogen atom or 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens).

8. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>8</sup> is hydrogen atom or 1-6C alkyl group.

9. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>9</sup> is

- (1) hydrogen atom,
- (2) 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 substituents selected from (i) halogen, (ii) hydroxy group, (iii) 1-6C alkoxy group, (iv) 1-6C alkylthio group, (v) 1-6C alkyl sulfinyl group, (vi) 1-6C alkylsulfonyl group, (vii) 1-6C alkyl-carbonyl oxy group or (viii) group represented by formula =N-OR<sup>14</sup> (wherein, R<sup>14</sup> has the same aforesaid meaning as described in Claim 2),
- (3) 3-6C cycloalkyl group,
- (4) 2-6C alkenyl group,
- (5) 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 of 1-6C alkoxy,
- (6) cyano group,
- (7) formyl group, or
- (8) hydroxy group.

10. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>10</sup> is hydrogen atom or 1-6C alkyl group.

11. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein R<sup>11</sup> is hydrogen atom, halogen atom, 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 1-6C alkoxy group, 1-6C alkylthio group, 1-6C alkyl sulfinyl group or 1-6C alkylsulfonyl group, and R<sup>12</sup> is hydrogen atom, halogen atom or 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens.

12. A compound or salts thereof in accordance with Claim 1, wherein

- R<sup>1</sup> is (1) phenyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 1-6C alkyl groups, 1-6C alkoxy groups, 1-6C alkylthio groups, 1-6C alkylsulfinyl groups or 1-6C alkylsulfonyl groups,
- (2) naphthyl group,

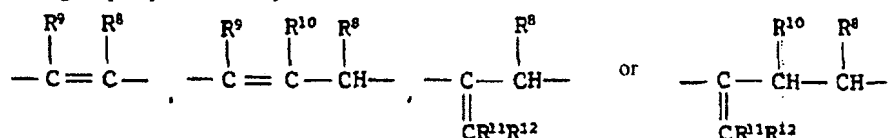
- (3) pyridyl group optionally substituted by 1-3 halogens,  
 (4) quinolyl group,  
 (5) isoquinolyl group,  
 (6) quinazolinyl group optionally substituted by 1-3 of 1-4C alkyl,  
 (7) imidazo[1,2-a]pyridyl group optionally substituted by 1-3 halogens,  
 (8) 1,4-benzodioxinyl group optionally substituted by 1-3 halogens,  
 (9) 2,3-dihydro-1,4-benzodioxinyl group optionally substituted by 1-3 halogens,  
 (10) benzofuranyl group, or  
 (11) (i) phenyl group optionally substituted by 1-3 substituents selected from halogen, 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl group, 2-6C alkynyl group, 1-6C alkoxy group, 1-6C alkylthio group optionally substituted by 1-3 halogens, 1-6C alkylsulfonyloxy group, formamide group, 1-6C alkyl-carbonylamino group and cyano group, or  
 (ii) carbamoyl group substituted by the thiazolyl group optionally substituted by 1-2 of 1-6C alkyl,

R2 and R3 each independently denote 1-6C alkyl group,

R4 is (1) phenyl group optionally substituted by 1-3 halogens or 1-6C alkyl groups, or

(2) 1-6C alkoxy group,

-A- denotes group represented by formula



(wherein, R8 denotes a hydrogen atom or 1-6C alkyl group,

R9 denotes (1) hydrogen atom, (2) 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 of halogen, hydroxy group, 1-6C alkoxy group, 1-6C alkylthio group, 1-6C alkyl sulfinyl group, 1-6C alkylsulfonyl group, 1-6C alkyl with carbonyl oxy group, hydroxyimino group, 1-6C alkoxyimino group or 1-6C alkyl-carbonyl oximino group, (3) 3-6C cycloalkyl group, (4) 2-6C alkenyl group, (5) 1-6C alkoxy group optionally substituted by 1-3 of 1-6C alkoxy group, (6) formyl group, (7) cyano group or (8) hydroxy group,

R10 denotes a hydrogen atom or 1-6C alkyl group,

R11 denotes a hydrogen atom, 1-6C alkyl group, 1-6C alkylthio group, 1-6C alkyl sulfinyl group or 1-6C alkylsulfonyl group, and

R12 denotes a hydrogen atom),

Z is (1) 1-6C alkoxy-carbonyl group optionally substituted by 1-3 halogens,

(2) 7-19 aralkyloxy-carbonyl group optionally substituted by 1-3 halogens,

(3) 1-6C alkyl-carbonyl group, or

(4) mono- or di-(1-6C alkyl) carbamoyl group.

13. Methyl 1-(1-(3,5-dichlorophenyl)-1-methylethyl)-1,3-dihydro-4-methyl-2-oxo-3-phenyl-2H-pyrrole-3-carboxylate or salts thereof.

14. Methyl 1-(1-(3,5-dichlorophenyl)-1-methylethyl)-4-methylene-2-oxo-3-phenylpyrrolidine-3-carboxylate or salts thereof.

15. Methyl 1-(1-(N-[2,5-dichlorophenyl] carbamoyl)-1-methylethyl)-1,3-dihydro-4-methyl-2-oxo-3-phenyl-2H-pyrrole-3-carboxylate or salts thereof

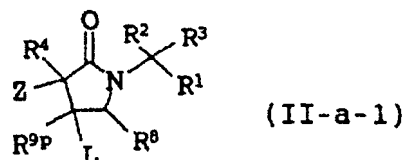
16. Methyl 1-(1-(3,5-dichlorophenyl)-1-methylethyl)-1,3-dihydro-3-(2-fluorophenyl)-4-methyl-2-oxo-2H-pyrrole-3-carboxylate or salts thereof.

17. Methyl 1-(1-(3,5-dichlorophenyl)-1-methylethyl)-3-(2-fluorophenyl)-4-methylene-2-oxopyrrolidin-3-carboxylate or salts thereof.

18. Methyl 1-(1-(N-[3,5-dichlorophenyl] carbamoyl)-1-methylethyl)-4-methylene-2-oxo-3-phenylpyrrolidine-3-carboxylate or salts thereof.

19. A process for the production of a compound or salts thereof in accordance with Claim 1, characterised in that:

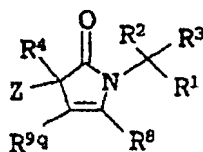
(1) a compound represented by formula



(wherein, R<sub>9p</sub> denotes a hydrogen atom, optionally substituted hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group, L denotes a leaving group, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is subjected to elimination reaction, thereby producing a compound represented by



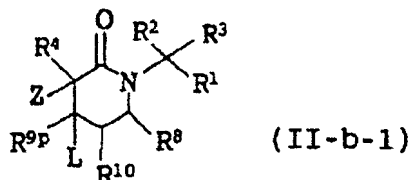
(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and in accordance with requirements the compound represented by aforesaid formula (I-a-1) or a salt thereof is reacted with an oxidant, and thereby producing a compound represented by formula



(I-a-2)

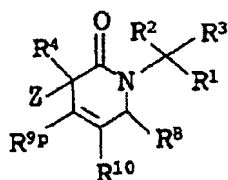
(wherein, R<sub>9q</sub> denotes optionally substituted acyl group, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(2) a compound represented by formula



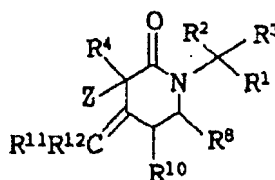
(II-b-1)

(wherein, R<sub>9p</sub> and L have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is subjected to elimination reaction, thereby producing a compound represented by



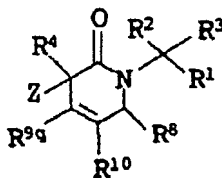
(I-b-1)

and/or



(I-d)

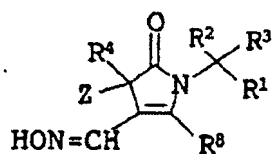
(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and in accordance with requirements the compound represented by aforesaid formula (I-b-1) or a salt thereof is reacted with an oxidant, and thereby producing a compound represented by formula



(I-b-2)

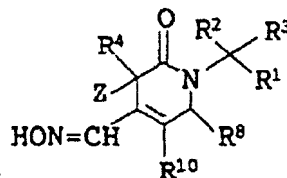
(wherein, R<sub>9q</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(3) a compound represented by formula



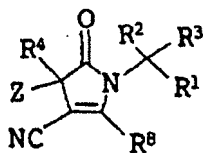
(I-a-1a'')

or



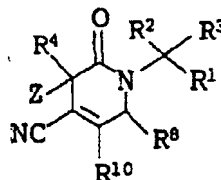
(I-b-1a'')

(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is subjected to dehydration reaction, and thereby producing a compound represented by



(I-a-4)

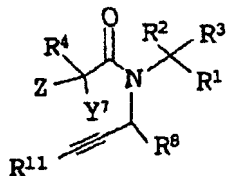
or



(I-b-4)

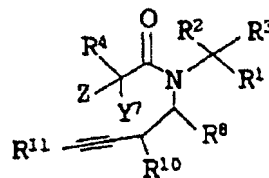
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(4) a compound represented by formula



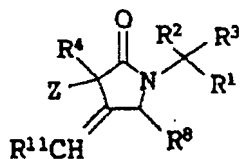
(III-c-1)

or



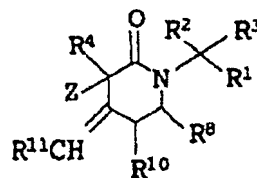
(III-d-1)

(wherein, Y7 denotes a halogen atom, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is subjected to ring closure reaction, thereby producing a compound represented by



(I-c-1)

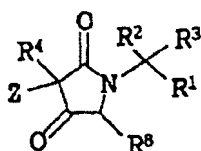
or



(I-d-1)

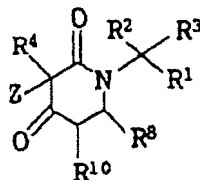
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(5) a compound represented by formula



(II-a-3)

or

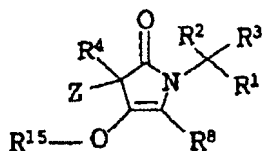


(II-b-3)

(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with a compound represented by formula

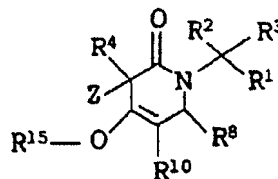
R15-L4

(wherein, L4 denotes leaving group, and R15 has the same meaning as described in Claim 1) or salt thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-a-3)

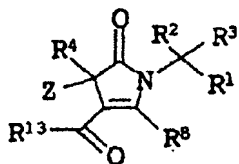
or



(I-b-3)

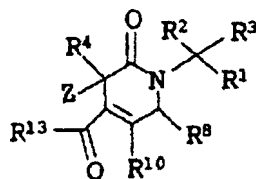
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(6) a compound represented by formula



(I-a-2a)

or

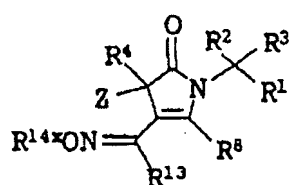


(I-b-2a)

(wherein, R13 denotes hydrogen atom, or (i) 1-6C alkyl group, (ii) 6-14C aryl group or (iii) 7-19C aralkyl group, each of which may be substituted by 1-3 halogens, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with a compound represented by formula

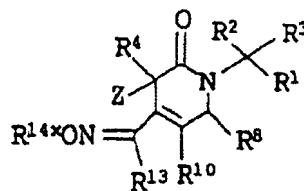
R<sup>14x</sup>ONH<sub>2</sub>

(wherein, R14x denotes a hydrogen atom or 1-6C alkyl group) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-a-1a)

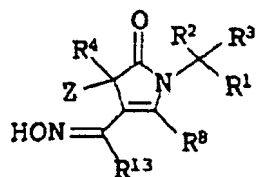
or



(I-b-1a)

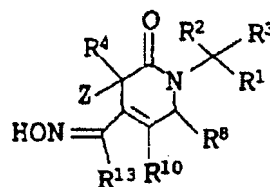
(wherein, R13 and R14x have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(7) a compound represented by formula



(I-a-1a')

or

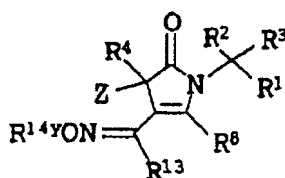


(I-b-1a')

(wherein, R13 has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with a compound represented by formula

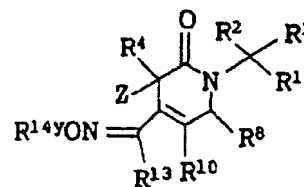


(wherein, R14y denotes 1-6C alkyl-carbonyl group optionally substituted by 1-3 halogens, and L2 denotes leaving group) or salts thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-a-1b)

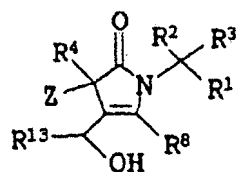
or



(I-b-1b)

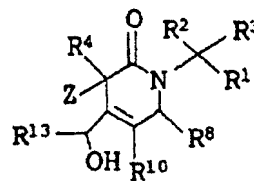
(wherein, R13 and R14y have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(8) a compound represented by formula (I-a-2a) or (I-b-2a) or a salt thereof in accordance with the aforesaid (6) is reacted with reducing agent, and thereby producing a compound represented by formula



(I-a-1c)

or

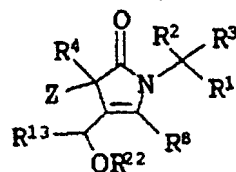


(I-b-1c)

(wherein, R13 has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and in accordance with requirements, a compound represented by the aforesaid formula (I-a-1c) or (I-b-1c) or a salt thereof is reacted with a compound represented by formula

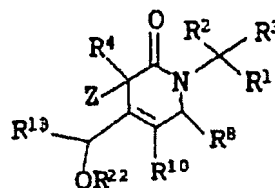


(wherein, R22 denotes (i) 1-6C alkyl group or (ii) 1-6C alkyl-carbonyl group, each of which may be substituted with 1-3 halogens, and L6 denotes leaving group) or salts thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-a-1d)

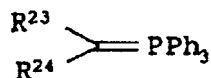
or



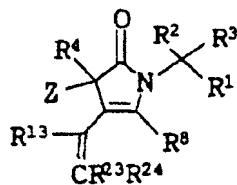
(I-b-1d)

(wherein, R13 and R22 have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(9) a compound represented by formula (I-a-2a) or (I-b-2a) or a salt thereof in accordance with the aforesaid (6) is reacted with a compound represented by

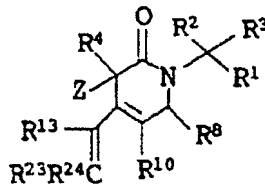


(wherein, R23 and R24 each independently denote hydrogen atom, halogen atom, 1-6C alkyl group or 1-6C alkoxy group, and Ph denotes phenyl group) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-a-1e)

or

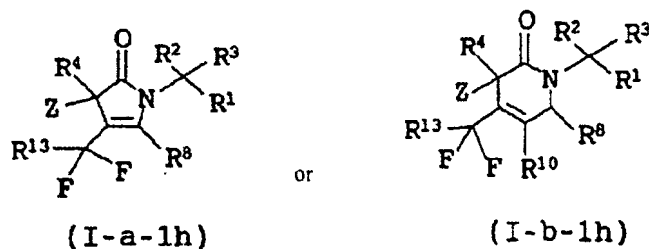


(I-b-1e)



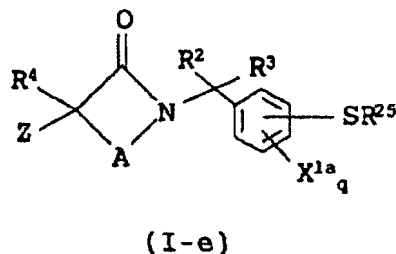
(wherein, R13, R23 and R24 have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(10) a compound represented by formula (1-a-2a) or (1-b-2a) or a salt thereof in accordance with the aforesaid (6) is reacted with a fluorinating agent, and thereby producing a compound represented by

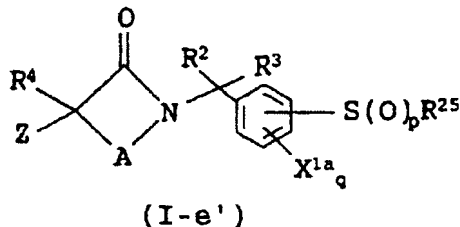


(wherein, R13 has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(11) a compound represented by formula

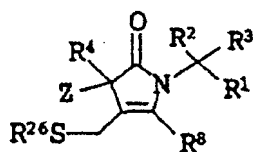


(wherein, R25 denotes 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, 2-6C alkenyl group, 2-6C alkynyl group or phenyl group, and q denotes an integer of 0-2, and X1a is the same or different and denotes halogen atom or 1-6C alkyl group optionally substituted by 1-3 halogens, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with an oxidant, and thereby producing a compound represented by

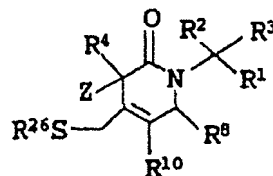


(wherein, p denotes 1 or 2, and R25, X1a and q have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(12) a compound represented by formula

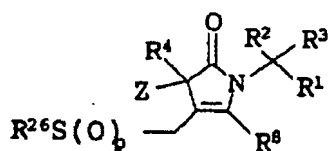


(I-a-1f)

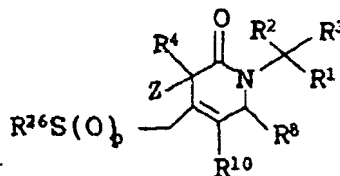


(I-b-1f)

(wherein, R26 denotes 1-6C alkyl group, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with an oxidant, and thereby producing a compound represented by



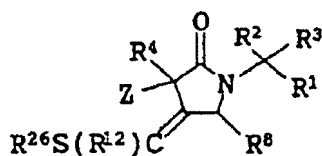
(I-a-1g)



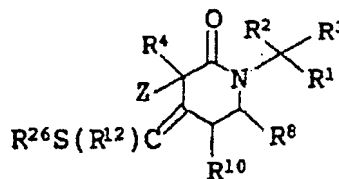
(I-b-1g)

(wherein, R26 and p have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(13) a compound represented by formula

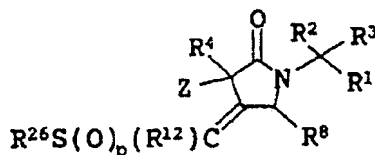


(I-c-2)

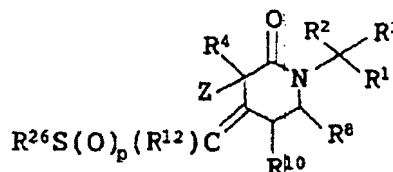


(I-d-2)

(wherein, R26 has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with an oxidant, and thereby producing a compound represented by



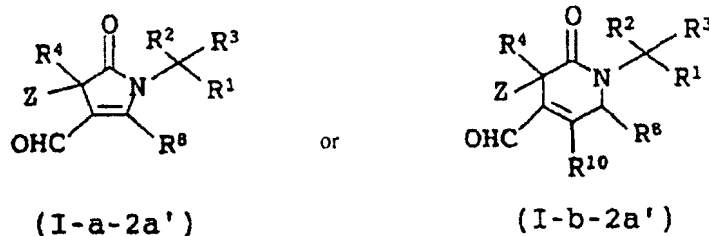
(I-c-3)



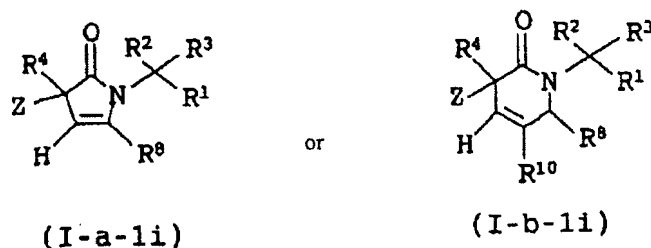
(I-d-3)

(wherein, R26 and p have the same aforesaid meanings, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(14) a compound represented by formula

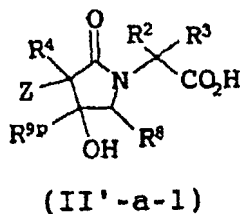


(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with an organic rhodium complex, and thereby producing a compound represented by



(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

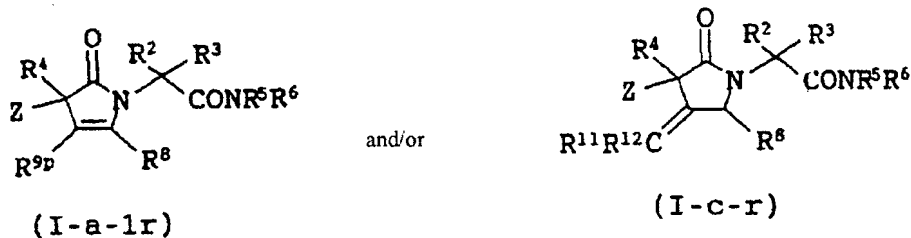
(15) a compound represented by formula



(wherein, R<sup>9p</sup> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with halogenating agent and thereafter, is reacted with a compound represented by formula

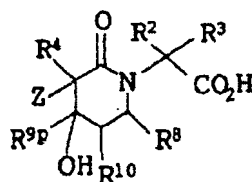


(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by



(wherein, R<sup>9p</sup> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(16) a compound represented by formula

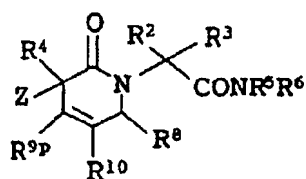


(II'-b-1)

(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with halogenating agent and thereafter, is reacted with a compound represented by formula

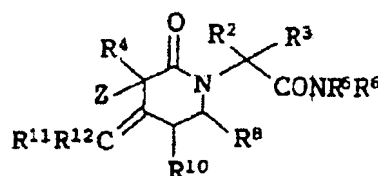


(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by



(I-b-1r)

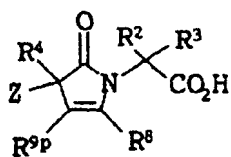
and/or



(I-d-r)

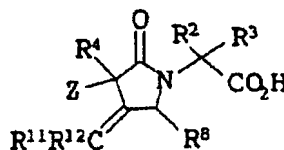
(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof;

(17) a compound represented by formula



(I'-a-1)

or



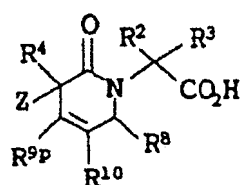
(I'-c-1)

(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with halogenating agent and thereafter, the obtained acid halide compound is reacted with a compound represented by formula



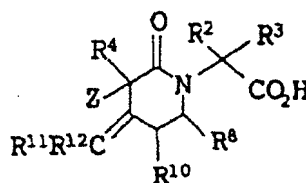
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by formula (I-a-1r) or (I-c-r) or a salt thereof in accordance with the aforesaid (15); or

(18) a compound represented by formula



(I' -b-1)

or



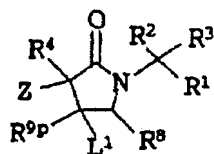
(I' -d-1)

(wherein, R<sub>9p</sub> has the same aforesaid meaning, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof is reacted with halogenating agent and thereafter, the obtained acid halide compound is reacted with a compound represented by formula



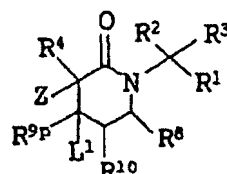
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1) or a salt thereof, and thereby producing a compound represented by formula (1-b-1r) or (1-d-r) or a salt thereof in accordance with the aforesaid (16).

20. A compound or salts thereof represented by formula



(II-a-1x)

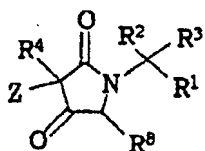
or



(II-b-1x)

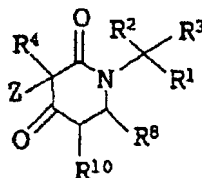
[wherein, R<sub>9p</sub> has same the aforesaid meaning as Claim 19, L<sub>1</sub> denotes halogen atom, hydroxy group, or a group represented by -OS(O)Cl or a compound represented by formula -OS(O)<sub>2</sub>R<sup>18</sup> (wherein, R<sup>18</sup> denotes optionally substituted hydrocarbon group), and other symbols have the same meanings as described in Claim 1)].

21. A compound or salts thereof represented by formula



(II-a-3)

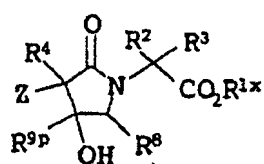
or



(II-b-3)

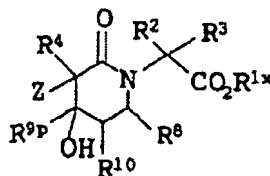
(wherein, each symbol has the same meanings as described in Claim 1).

22. A compound or salts thereof represented by formula



(II' -a)

or



(II' -b)

(wherein,  $\text{R}^{1x}$  denotes a hydrogen atom, benzyl group or tert-butyl group, and  $\text{R}^{9p}$  has the same aforesaid meaning as described in Claim 19, and other symbols have the same meanings as described in Claim 1).

23. A herbicide containing compounds or salts thereof in accordance with Claim 1.
24. A herbicide in accordance with Claim 23 that is a herbicide for paddy field.
25. The use of compounds in accordance with Claim 1 as herbicide.
26. Weeding process of paddy field weeds characterised in that compounds or salts thereof in accordance with Claim 1 are applied to paddy field.
27. A surface floating granular agent containing compounds or salts thereof in accordance with Claim 1.
28. A surface floating granular agent in accordance with Claim 27, characterized by further containing binding agent, surface active agent and powder base having specific gravity of 1 or less.
29. A surface floating granular agent in accordance with Claim 28, wherein the binding agent is one kind or more to be selected from carboxymethylcellulose or salts thereof and polycarboxylic acid system polymer compound or salts thereof.
30. A surface floating granular agent in accordance with Claim 28, wherein the surface active agent is at least one selected from the alkyl sulfosuccinate or acetylene glycol system surface active agent.
31. A surface floating granular agent in accordance with Claim 28, wherein the powder base having specific gravity of 1 or less is pearlite.

32. A surface floating granular agent in accordance with Claim 27, wherein an organic solvent is contained furthermore.
33. A surface floating granular agent in accordance with Claim 32, wherein the organic solvent is methylnaphthalene.
34. A surface floating granular agent in accordance with Claim 27, characterized in that other herbicidal component is contained furthermore.
35. A surface floating granular agent in accordance with Claim 34, wherein the other herbicidal component is imazosulfuron.
36. A surface floating granular agent in accordance with Claim 27, which is wrapped by 20-200g units in water-soluble film.
37. An aqueous suspension agent containing compounds or salts thereof in accordance with Claim 1.
38. An aqueous suspension agent in accordance with Claim 37, characterized in that a surface active agent is contained furthermore.
39. An aqueous suspension agent in accordance with Claim 38, wherein the surface active agent is one kind or more to be selected from alkyl sulfosuccinate and polyoxyethylene alkyl aryl phosphonic acid ester salt.
40. An aqueous suspension agent in accordance with Claim 37, characterized in that other herbicidal component is contained furthermore.
41. An aqueous suspension agent in accordance with Claim 40, wherein the other herbicidal component is imazosulfuron.

**Rising Sun Communications Ltd. Terms and Conditions (Abbreviated)**

Rising Sun Communications Ltd. shall not in any circumstances be liable or responsible for the accuracy or completeness of any translation unless such an undertaking has been given and authorised by Rising Sun Communications Ltd. in writing beforehand. More particularly, Rising Sun Communications Ltd. shall not in any circumstances be liable for any direct, indirect, consequential or financial loss or loss of profit resulting directly or indirectly from the use of any translation or consultation services by the customer.

Rising Sun Communications Ltd. retains the copyright to all of its' translation products unless expressly agreed in writing to the contrary. The original buyer is permitted to reproduce copies of a translation for their own corporate use at the site of purchase, however publication in written or electronic format for resale or other dissemination to a wider audience is strictly forbidden unless by prior written agreement.

The Full Terms and Conditions of Business of Rising Sun Communications may be found at the web site address <[http://www.risingsun.co.uk/Terms\\_of\\_business.html](http://www.risingsun.co.uk/Terms_of_business.html)>